PA IT COOPERATION TREATY

From the INTERNATIONAL BUREAU

	TIGHT THE INTERNATIONAL BOILEAU
PCT	То:
NOTIFICATION OF ELECTION	Assistant Commissioner for Patents
(PCT Rule 61.2)	United States Patent and Trademark Office
	Box PCT Washington, D.C.20231 ETATS-UNIS D'AMERIQUE
Day of a diagram	TI ETATS-UNIS D'AIMERIQUE
Date of mailing: 05 October 2000 (05.10.00)	in its capacity as elected Office
International application No.: PCT/EP00/02292	Applicant's or agent's file reference: LEA33628-WO
International filing date: 15 March 2000 (15.03.00)	Priority date: 27 March 1999 (27.03.99)
Applicant: MÜLLER, Klaus-Helmut et al	
1. The designated Office is hereby notified of its election made	de:
X in the demand filed with the International preliminar	v Examining Authority on:
01 August 200	
Of August 200	00 (01.00.00)
in a notice effecting later election filed with the Inter	national Bureau on:
<u> </u>	
2. The election X was	
was not	
	A second
made before the expiration of 19 months from the priority Rule 32.2(b).	date or, where Rule 32 applies, within the time limit under
The International Bureau of WIPO	Authorized officer:
34, chemin des Colombettes 1211 Geneva 20, Switzerland	1. 7 ahua
Facsimile No.: (41-22) 740.14.35	J. Zahra Telephone No.: (41-22) 338.83.38

Form PCT/IB/331 (July 1992)

3549617

PCT

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

(Artikel 18 sowie Regeln 43 und 44 PCT)

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts LEA33628-W0	WEITERES siehe Mitteilung über Recherchenberichts VORGEHEN zutreffend, nachstehe	die Übermittlung des internationalen (Formblatt PCT/ISA/220) sowie, soweit ender Punkt 5
Internationales Aktenzeichen	Internationales Anmeldedatum	(Frühestes) Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr)
DOT /58 00 / 00000	(Tag/Monat/Jahr)	27/03/1999
PCT/EP 00/02292	15/03/2000	27/03/1999
Anmelder		
BAYER AG		
Dieser internationale Recherchenbericht wur Artikel 18 übermittelt. Eine Kopie wird dem Ir	de von der Internationalen Recherchenbehörde Iternationalen Būro übermittelt.	erstellt und wird dem Anmelder gemäß
Dieser internationale Recherchenbericht umf X Darüber hinaus liegt ihm je	aßt insgesamt <u>4</u> Blätter. weils eine Kopie der in diesem Bericht genannte	en Unterlagen zum Stand der Technik bei.
Grundlage des Berichts		
 a. Hinsichtlich der Sprache ist die inte durchgeführt worden, in der sie ein 	ernationale Recherche auf der Grundlage der in gereicht wurde, sofern unter diesem Punkt nicht	ternationalen Anmeldung in der Sprache s anderes angegeben ist.
Die internationale Recherci Anmeldung (Regel 23.1 b))	he ist auf der Grundlage einer bei der Behörde e durchgeführt worden.	eingereichten Übersetzung der internationalen
Recherche auf der Grundlage des	en Anmeldung offenbarten Nucleotid- und/ode Sequenzprotokolls durchgeführt worden, das	er Aminosäuresequenz ist die internationale
	eldung in Schriflicher Form enthalten ist.	ingereight worden ist
	ionalen Anmeldung in computerlesbarer Form e	Ingereicht worden ist.
	ch in schriftlicher Form eingereicht worden ist. ch in computerlesbarer Form eingereicht wordei	n iet
Die Erklärung, daß das nach	chträglich eingereichte schriftliche Sequenzproto	koll nicht über den Offenbarungsgehalt der
internationalen Anmeldung	im Anmeldezeitpunkt hinausgeht, wurde vorgel	egt.
Die Erklärung, daß die in c wurde vorgelegt.	omputeriesbarer Form erfasten informationen d	em schriftlichen Sequenzprotokoll entsprechen,
2. Bestimmte Ansprüche ha	aben sich als nicht recherchierbar erwiesen (siehe Feld I).
3. Mangelnde Einheitilchke	lt der Erfindung (siehe Feld II).	
4. Hinsichtlich der Bezelchnung der Erfl	ndung	
wird der vom Anmelder eir	ngereichte Wortlaut genehmigt.	
	r Behörde wie folgt festgesetzt:	
SUBSTITUIERTE BENZOYLP	YRAZOLE ALS HERBIZIDE	
5. Hinsichtlich der Zusammenfassung		
wird der vom Anmelder eir	ngereichte Wortlaut genehmigt.	•
wurde der Wortlaut nach F Anmelder kann der Behörd Recherchenberichts eine S	legel 38.2b) in der in Feld III angegebenen Fass de innerhalb eines Monats nach dem Datum der Stellungnahme vorlegen.	sung von der Behörde festgesetzt. Der Absendung dieses internationalen
	ist mit der Zusammenfassung zu veröffentliche	n: Abb. Nr
wie vom Anmelder vorges		keine der Abb.
weii der Anmelder selbst k	eine Abbildung vorgeschlagen hat.	
weil diese Abbildung die E	rfindung besser kennzeichnet.	



Internationales Aktenzeichen

T/EP 00/02292

Feld III

WORTLAUT DER ZUSAMMENFASSUNG (Fortsetzung von Punkt 5 auf Blatt 1)

Die Erfindung betrifft neue substituierte Benzoylpyrazole der allgemeinen Formel (I),

$$\begin{array}{c|c}
R^{2} & O & (R^{4})_{n} \\
N & A Z \\
R^{1} & R^{3}
\end{array}$$
(I)

in welcher

für eine gegebenenfalls substituierte 4- bis 12-gliedrige, gesättigte oder ungesättigte, monocyclische oder bicyclische, heterocyclische Gruppierung steht, welche 1 bis 4 Heteroatome (bis zu 4 Stickstoffatome und gegebenenfalls - alternativ oder additiv - ein Sauerstoffatom oder ein Schwefelatom, oder eine SO-Gruppierung oder eine SO2-Gruppierung) enthält, und welche zusätzlich ein bis drei Oxo-Gruppen (C=O) und/oder Thioxo-Gruppen (C=S) als Bestandteile des Heterocyclus enthält,

sowie Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Herbizide.

Internationales Aktenzeichen EP 00/02292

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGS GENSTANDES IPK 7 C07D403/10 A01N43/653

C07D471/04

C07D231/20

A01N43/56 C07D413/10 C07D401/10 C07D487/04 C07D417/10

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole) $IPK \ 7 \ CO7D \ A01N$

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

EPO-Internal, CHEM ABS Data, WPI Data

Kategorie°	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	WO 99 07697 A (DEYN WOLFGANG VON ;HILL REGINA LUISE (DE); RHEINHEIMER JOACHIM (DE) 18. Februar 1999 (1999-02-18) Seite 78, Zeile 21 -Seite 79, Zeile 7	1,8-10
X	WO 98 42678 A (DOW AGROSCIENCES LLC) 1. Oktober 1998 (1998-10-01) Seite 50, Zeile 19 -Seite 51, Zeile 15	1,8
A	WO 98 31681 A (DEYN WOLFGANG VON ;HILL REGINA LUISE (DE); RHEINHEIMER JOACHIM (DE) 23. Juli 1998 (1998-07-23) Anspruch 1	1,9,10
Α	EP 0 900 795 A (NIPPON SODA CO) 10. März 1999 (1999-03-10) Ansprüche	1,9,10

X Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen	X Siehe Anhang Patentfamilie
 Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen "A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist "E" älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist "L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt) "O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht "P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist 	kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist *&* Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist
Datum des Abschlusses der internationalen Recherche	Absendedatum des internationalen Recherchenberichts
17. Juli 2000	27/07/2000
Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde	Bevollmächtigter Bediensteter
Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL – 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax: (+31-70) 340-3016	De Jong, B

5

Internationa	les Aktenzelchen	-
PEP	00/02292	

	ng) ALS WESENTLICH ANGESETENE UNTERLAGEN Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
Kategorie*	Bezeichnung der Veroffentlichung, soweit enordenich unter Angabe der in betracht kommenden Felie	Bett. Anspiden Nr.
1	US 5 846 907 A (HILL REGINA LUISE ET AL) 8. Dezember 1998 (1998-12-08) Ansprüche; Beispiele	1,9,10
į		

5

Angaben zu Veröffentlichung

zur selben Patentfamilie gehören

nales Aktenzeichen PCT/EP 00/02292

Im Recherchenberici	ht	Datum der			EP 00/02292
angeführtes Patentdoku	ment	Veröffentlichung		Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 9907697	Α	18-02-1999	AL	9066598 A	
			EF		01-03-1999 31-05-2000
WO 9842678	Α	01-10-1998	<u> </u>		31-03-2000
	••	01 -10-1998	AU	Jajo 7	20-10-1998
			EP US		02-06-1999
			US	A	20-10-1998
WO 9831681				5962690 A	05-10-1999
MO 3031001	A	23-07-1998	AU	6092998 A	07-08-1998
			ŲĄ	6207698 A	07-08-1998
			AU	6613398 A	07-08-1998
			CN	1248255 T	22-03-2000
			CN	1250447 T	12-04-2000
			WO WO	9831676 A	23-07-1998
			EP	9831682 A	23-07-1998
			EP	0966452 A	29-12-1999
			ËP	0958291 A 0958292 A	24-11-1999
			NO	993521 A	24-11-1999
			NO	993522 A	15-09-1999
			PL	334847 A	16-09-1999 27-03-2000
			PL	334849 A	27-03-2000 27-03-2000
			SK	90399 A	10-12-1999
			SK	91999 A	18-01-2000
EP 0900795	A	10-03-1999	JP	10007673 A	
			AU	1671097 A	13-01-1998 19-11-1997
			BR	9708828 A	03-08-1999
			AU	1670797 A	19-11-1997
			AU	1670897 A	17-10-1997
			AU	1670997 A	19-11-1997
			AU Ca	2405897 A	19-11-1997
			CN	2252543 A 1216534 A	06-11-1997
			CN	1216543 A	12-05-1999
			EP	0891972 A	12-05-1999
			HU	9902423 A	20-01-1999
	•	,	JP	10237072 A	29-11-1999 08-09-1998
			WO	9741116 A	06-09-1998
			WO	9735850 A	02-10-1997
		•	WO	9741117 A	06-11-1997
•			WO WO	9741118 A	06-11-1997
			WO	9741105 A 9821187 A	06-11-1997
US 5846907 A		00 10 1000			22-05-1998
, A		08-12-1998	AU	710172 B	16-09-1999
			AU BG	4665596 A	11-09-1996
			BR	101825 A	30-04-1998
			CA	9607333 A 2210693 A	25-11-1997
			CN	1175951 A	29-08-1996
				9702473 A	11-03-1998
			_	9626206 A	13-05-1998
			EP	0811007 A	29-08-1996 10-12-1997
			FI	973471 A	22-08-1997
			HU	9800725 A	28-07-1998
			JP 1	1500438 T	12-01-1999
			LT	97145 A,B	** OT T224

Angaben zu Veröffentlichus

e zur seiben Patentfamilie gehören

Jonales Aktenzeichen FCT/EP 00/02292

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument			Datum der Veröffentlichung
US 5846907 A		LV 11895 A LV 11895 B NO 973861 A NZ 301272 A PL 322277 A SK 104297 A	20-12-1997 20-03-1998 22-10-1997 25-02-1999 19-01-1998 08-07-1998

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

information on patent family members

Publication Patent family **Publication** Patent document member(s) date cited in search report date AU 9066598 A 01-03-1999 Α 18-02-1999 WO 9907697 EP 1003736 A 31-05-2000 20-10-1998 AU 6579198 A WO 9842678 Α 01-10-1998 02-06-1999 ΕP 0918755 A US 5824802 A 20-10-1998 05-10-1999 US 5962690 A ΑU 6092998 A 07-08-1998 23-07-1998 WO 9831681 Α 07-08-1998 ΑU 6207698 A 07-08-1998 ΑU 6613398 A 1248255 T 22-03-2000 CN 1250447 T 12-04-2000 CN 23-07-1998 WO 9831676 A WO 9831682 A 23-07-1998 29-12-1999 EP 0966452 A 24-11-1999 0958291 A EP 24-11-1999 EP 0958292 A 15-09-1999 NO 993521 A 993522 A 16-09-1999 NO 27-03-2000 334847 PL PL 334849 A 27-03-2000 10-12-1999 90399 A SK 18-01-2000 91999 A SK JP 10007673 A 13-01-1998 10-03-1999 EP 0900795 Α ΑU 1671097 A 19-11-1997 03-08-1999 9708828 A BR ΑU 1670797 19-11-1997 17-10-1997 AU 1670897 A 19-11-1997 ΑU 1670997 A 19-11-1997 ΑU 2405897 A CA 2252543 A 06-11-1997 12-05-1999 CN 1216534 A 1216543 A 12-05-1999 CN 20-01-1999 0891972 A EP 9902423 A 29-11-1999 HU 08-09-1998 10237072 A JP 06-11-1997 WO 9741116 A 02-10-1997 WO 9735850 A 06-11-1997 WO 9741117 A 9741118 A 06-11-1997 WO 06-11-1997 9741105 A WO WO 9821187 A 22-05-1998 16-09-1999 ΑU 710172 B US 5846907 Α 08-12-1998 11-09-1996 ΑU 4665596 A BG 101825 A 30-04-1998 BR9607333 A 25-11-1997 29-08-1996 2210693 A CA 11-03-1998 CN 1175951 A CZ 9702473 A 13-05-1998 29-08-1996 WO 9626206 A 10-12-1997 EP 0811007 A 22-08-1997 FΙ 973471 A 9800725 A 28-07-1998 HU JP 11500438 T 12-01-1999 26-01-1998 LT 97145 A.B

international Application No

EP 00/02292

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International	Application No	
EP	00/02292	

05 5040507 77	Publication date
NO 973861 A NZ 301272 A PL 322277 A	20-12-1997 20-03-1998 22-10-1997 25-02-1999 19-01-1998 08-07-1998

T 16

PCT

VERTRAG ÜBER I INTERNATIONALE ZUSAN ENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

PCT

REC'D 2 7 JUN 2001

WIPO

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT

(Artikel 36 und Regel 70 PCT)

Aktenzeichen LEA33628-	des Anmelders oder Anwalts WO Kri	WEITERES VORGEH		ung über die Übersendung de Prüfungsberichts (Formblatt P	
Internationale:	s Aktenzeichen /02292	Internationales Anmeldedatu 15/03/2000	um <i>(Tag/Monat/Jahr)</i>	Prioritätsdatum (Tag/Monat/127/03/1999	Tag)
Internationale C07D403/1	Patentklassifikation (IPK) oder r 0	nationale Klassifikation und IP	к	_	
Anmelder BAYER AG	et al.				
	nternationale vorläufige Prüf e erstellt und wird dem Anme			nalen vorläufigen Prüfung	beauftragten
2. Dieser E	BERICHT umfaßt insgesamt	5 Blätter einschließlich di	ieses Deckblatts.		
und	Berdem liegen dem Bericht A /oder Zeichnungen, die geä lörde vorgenommenen Berid	ndert wurden und diesem	Bericht zugrunde	liegen, und/oder Blätter mi	t vor dieser
Diese A	nlagen umfassen insgesam	t Blätter.			
3. Dieser E	Bericht enthält Angaben zu fo	olgenden Punkten:			
1	□ Grundlage des Berichts				
1	☐ Priorität				
	☐ Keine Erstellung eines (erfinderische Tätio	jkeit und gewerbliche Anw	endbarkeit
	☐ MangeInde Einheitlichke	_	udliah dar Narihait	das auficulariantes Thirte	
V		arkeit; Unterlagen und Erk		der erfinderischen Tätigke zung dieser Feststellung	at una dei
VI	☐ Bestimmte angeführte U	Interlagen	_		
VII	Bestimmte M\u00e4ngel der i	nternationalen Anmeldung			
VIII	Bestimmte Bemerkunge	en zur internationalen Anm	neldung		
Datum der Ein	reichung des Antrags	Da	atum der Fertigstellu	ng dieses Berichts	
01/08/2000)	25	5.06.2001		
Prüfung beauf	stanschrift der mit der internation tragten Behörde:	nalen vorläufigen Be	evollmächtigter Bedie	ensteter	S SO IS OF S MICHIGAN
	Europäisches Patentamt 0-80298 München Fel. +49 89 2399 - 0 Tx: 523656	epmu d	eelmann, I		
ļ ,	fax: +49 89 2399 - 4465 	Te	el. Nr. +49 89 2399 7	480	

		ŀ
2.		v

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT

Internationales Aktenzeichen PCT/EP00/02292

	Gru	ındlage des Bericht	s	
١.	Auf eing	forderung nach Artik	dteile der internationalen Anmeldung (Ersatzblätter, die dem Anmeldeamt auf eine el 14 hin vorgelegt wurden, gelten im Rahmen dieses Berichts als "ursprünglich m nicht beigefügt, weil sie keine Änderungen enthalten (Regeln 70.16 und 70.17)):	
	1-14	45 t	ursprüngliche Fassung	
	Pat	entansprüche, Nr.:		
	1-10	ο ι	ursprüngliche Fassung	
2.	die	internationale Anmel	e: Alle vorstehend genannten Bestandteile standen der Behörde in der Sprache, in der dung eingereicht worden ist, zur Verfügung oder wurden in dieser eingereicht, sofern ts anderes angegeben ist.	
		Bestandteile stande gereicht; dabei hande	n der Behörde in der Sprache: zur Verfügung bzw. wurden in dieser Sprache elt es sich um	
		die Sprache der Üb Regel 23.1(b)).	ersetzung, die für die Zwecke der internationalen Recherche eingereicht worden ist (nac	
		die Veröffentlichung	pssprache der internationalen Anmeldung (nach Regel 48.3(b)).	
		die Sprache der Üb ist (nach Regel 55.2	ersetzung, die für die Zwecke der internationalen vorläufigen Prüfung eingereicht worde 2 und/oder 55.3).	
3.			ternationalen Anmeldung offenbarten Nucleotid- und/oder Aminosäuresequenz ist die Prüfung auf der Grundlage des Sequenzprotokolls durchgeführt worden, das:	
		in der internationale	en Anmeldung in schriftlicher Form enthalten ist.	
		zusammen mit der i	internationalen Anmeldung in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.	
		bei der Behörde nach	chträglich in schriftlicher Form eingereicht worden ist.	
		bei der Behörde na	chträglich in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.	
 Die Erklärung, daß das nachträglich eingereichte schriftlishe Sequenzprotokoll nicht über den Offenbarungsgehalt der internationalen Anmeldung im Anmeldezeitpunkt hinausgeht, wurde vorg 				
			die in computerlesbarer Form erfassten Informationen dem schriftlichen ntsprechen, wurde vorgelegt.	
1.	Auf	grund der Änderunge	en sind folgende Unterlagen fortgefallen:	
		Beschreibung,	Seiten:	
		Ansprüche,	Nr.:	

Blatt:

☐ Zeichnungen,

•
¥

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT

Internationales Aktenzeichen PCT/EP00/02292

5. Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung (von einigen) der Änderungen erstellt worden, da diese aus den angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde über den Offenbarungsgehalt in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgehen (Regel 70.2(c)).

(Auf Ersatzblätter, die solche Änderungen enthalten, ist unter Punkt 1 hinzuweisen;sie sind diesem Bericht beizufügen).

- 6. Etwaige zusätzliche Bemerkungen:
- V. Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung
- 1. Feststellung

Neuheit (N) Ja: Ansprüche 4

Nein: Ansprüche 1-3, 5-10

Erfinderische Tätigkeit (ET) Ja: Ansprüche

Nein: Ansprüche 1-10

Gewerbliche Anwendbarkeit (GA) Ja: Ansprüche 1-10

Nein: Ansprüche

2. Unterlagen und Erklärungen siehe Beiblatt

VII. Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung

Es wurde festgestellt, daß die internationale Anmeldung nach Form oder Inhalt folgende Mängel aufweist: siehe Beiblatt

VIII. Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung

Zur Klarheit der Patentansprüche, der Beschreibung und der Zeichnungen oder zu der Frage, ob die Ansprüche in vollem Umfang durch die Beschreibung gestützt werden, ist folgendes zu bemerken: siehe Beiblatt

	•
	ý

Zu Punkt V

Begründete Feststellung nach Regel 66.2(a)(ii) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

Die vorliegende Anmeldung erfüllt nicht die Erfordernisse des Artikels 33 (2) PCT, da ein Teil der im unabhängigen Anspruch 1 beanspruchten Verbindungen bereits aus D1 und D2 bekannt ist. Der Anspruchsgegenstand kann auch nicht als neue Auswahl gegenüber dem Stand der Technik angesehen werden. Die allgemeine Formel I in Anspruch 1 von D1 überlappt mit der gegenwärtigen Formel (I) außerdem fallen viele Verbindungen der Tabelle A (vgl. Seiten 26-31 und 45-47) von D1 ebenfalls unter die Formel (I) der Anmeldung. Das gleiche gilt für die allgemeine Strukturformel in Anspruch 1 von D2. Sie überschneidet sich mit der gegenwärtigen Formel (I), außerdem fallen die meisten Verbindungen der Tabelle 1 (vgl. Seiten 11-20) von D2 unter die Formel (I) der Anmeldung. Die Ansprüche 2, 3, 5 und 7 bis 10 sind ebenfalls von D1 und D2 und Anspruch 6 nur von D1 neuheitsschädlich getroffen (für Anspruch 7 vgl. u.a. Anspruch 6 von D1 und D2, Seite 30). Darüber hinaus überlappen auch die Anspruchsgegenstände von D3, D4 und D5 mit den gegenwärtigen Ansprüchen.

Der Gegenstand des Anspruchs 4 scheint neu zu sein.

Die Beurteilung der erfinderischen Tätigkeit bezieht sich nur auf Verbindungen für die Neuheit anerkannt werden kann. Den nächstliegenden Stand der Technik bilden die Dokumente D1 und D2. Die beschriebenen Verbindungen haben qualitativ die gleiche Wirkung wie die gegenwärtig beanspruchten. Aus den Dokumenten D3 bis D5 sind weitere relevante Benzoylpyrazol-Derivate mit herbiziden Eigenschaften bekannt. Als Aufgabe der vorliegenden Erfindung kann nicht das zur Verfügung stellen weiterer herbizid wirksamer Benzoylpyrazol-Derivate gesehen werden, da die Lösung für den Fachmann in Hinblick auf D1 und D2 offensichtlich wäre.

Die der Anmeldung zugrundeliegende Aufgabe muß daher unter dem Aspekt neuer Derivate, die unerwartete oder überraschende Eigenschaften gegenüber dem nächsten Stand der Technik (D1 und D2) aufweisen, gesehen werden. Ohne vergleichende Testergebnisse, kann nicht beurteilt werden, ob die Erfindung die Erfordernisse des Artikels 33(3) PCT erfüllt.

Zu Punkt VII

Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung

Um die Erfordernisse der Regel 5.1 a) ii) PCT zu erfüllen, sollte in der Beschreibung das Dokument D2 genannt werden.

Zu Punkt VIII

Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung

Die Definition von Z in Anspruch 1 spricht von 1 - 4 Heteroatomen, in der Klammer werden bis zu 4 N-Atome und gegebenenfalls "additiv" (eine Möglichkeit) ein O- oder S-Atom genannt. Es ergibt sich die Möglichkeit von mehr als 4 Heteroatomen, anderenfalls würde die Bezeichnung "alternativ" ausreichen (Artikel 6 PCT).

Anspruch 7. c) scheint nicht klar bzw. die Reaktion nicht ausführbar zu sein. Um das Zielmolekühl zu erhalten, müßte H₂ abgespalten werden. Gemäß Seite 54 der Beschreibung sollte statt H-Y (wie in Anspruch 7) ein Cl-Y eingestzt werden (Artikel 5 und 6 PCT).

Der Gegenstand des Anspruchs 8 ist durch Y = H in Anspruch 1 bereits explizit genannt, der Anspruch 8 erscheint daher überflüssig zu sein.

Da Q in Anspruch 1 nicht definiert ist, erscheint der Bezug in Anspruch 5 sinnlos.

**			•
			v
		į.	
		· •	

PATENT COOPERATION TREATY

PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

(PCT Article 36 and Rule 70)

Applicant's or agent's file reference LEA33628-WO		Notification of Transmittal of International nary Examination Report (Form PCT/IPEA/416)			
International application No.	International filing date (day/month/yea				
PCT/EP00/02292	15 March 2000 (15.03.00)	27 March 1999 (27.03.99)			
International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC C07D 403/10, A01N 43/653, 43/56, C07D 401/10, 417/10, 471/04, 231/20, 413/10, 487/04					
Applicant	BAYER AKTIENGESELLSCH	AFT			
 This international preliminary examination report has been prepared by this International Preliminary Examining Authority and is transmitted to the applicant according to Article 36. 					
2. This REPORT consists of a total of	5 sheets, including this co	over sheet.			
This report is also accompanied by ANNEXES, i.e., sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and are the basis for this report and/or sheets containing rectifications made before this Authority (see Rule 70.16 and Section 607 of the Administrative Instructions under the PCT).					
These annexes consist of a total of sheets.					
3. This report contains indications rela	ting to the following items:				
J Basis of the report					
II Priority					
III Non-establishment	t of opinion with regard to novelty, inver	tive step and industrial applicability			
IV Lack of unity of in	vention				
V Reasoned statemer citations and expla	nt under Article 35(2) with regard to nov mations supporting such statement	elty, inventive step or industrial applicability;			
VI Certain documents	cited				
VII Certain defects in t	the international application				
VIII Certain observatio	VIII Certain observations on the international application				
-					
Date of submission of the demand	Date of comple	tion of this report			
01 August 2000 (01.0)	8.00)	25 June 2001 (25.06.2001)			
Name and mailing address of the IPEA/EP	Authorized offi	сег			
Facsimile No	Telephone No.				

•				•
			,	



International application No.

PCT/EP00/02292

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

I. Basis of the report								
1. This repor	t has been drawn of	on the basis of	(Replacement sheet s "originally filed"	is which have been furnished to the receiving Office in response to an invitation and are not annexed to the report since they do not contain amendments.):				
	the international	application as	originally filed.					
\boxtimes	the description,	pages	1-145	_, as originally filed,				
		pages		_, filed with the demand,				
		pages		, filed with the letter of				
		pages		, filed with the letter of				
\boxtimes	the claims,	Nos.	1-10	_ , as originally filed,				
		Nos.		, as amended under Article 19,				
		Nos.		_ , filed with the demand,				
		Nos		, filed with the letter of,				
		Nos		, filed with the letter of				
	the drawings,	sheets/fig		_ , as originally filed,				
		sheets/fig		_ , filed with the demand,				
		sheets/fig		_ , filed with the letter of ,				
		sheets/fig		_ , filed with the letter of				
2. The amend	Iments have resulte	ed in the cance	llation of:					
	the description,	pages						
	the claims,							
	the drawings,							
	<u></u>							
3. This to go	report has been es beyond the disclo	stablished as if osure as filed,	(some of) the am as indicated in the	nendments had not been made, since they have been considered e Supplemental Box (Rule 70.2(c)).				
4. Additional	observations, if ne	ecessary:						
		-		-				

			•
	₩î		

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.
PCT/EP 00/02292

V. Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement

Statement			
Novelty (N)	Claims	4	YES
	Claims	1-3, 5-10	NO
Inventive step (IS)	Claims		YES
	Claims	1-10	NO
Industrial applicability (IA)	Claims	1-10	YES
	Claims		NO

2. Citations and explanations

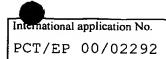
The application fails to meet the requirement of PCT Article 33(2) because some of the compounds defined in Claim 1 are already known from documents D1 and D2. The claimed subject matter cannot be regarded as a novel selection compared with the prior art. There is an overlap between general formula (I) in D1 and general formula (I) in Claim 1 of the present application, and moreover many of the compounds specified in Table A in D1 (pages 26-31 and 45-47) are covered by formula (I) in the present application. The same applies to the general structural formula in Claim 1 of D2, which overlaps with formula (I) in the present application. Moreover, most of the compounds specified in Table 1 in D2 (pages 11-20) are covered by formula (I) in the present application. Claims 2, 3, 5 and 7-10 are also anticipated by both D1 and D2, and Claim 6 is anticipated by D1. For Claim 7, see (for example) Claim 6 in D1 and D2, page 30. The subject matter defined in the claims in documents D3, D4 and D5 also overlaps with that of the present claims.

The subject matter of Claim 4 appears to be novel.

The assessment of inventive step can only apply to compounds that may be considered novel. The closest prior art is found in D1 and D2, which describe compounds that have the same

			•	,	•
		•			

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT



effect in qualitative terms as those claimed in the present application. Documents D3 to D5 also describe other relevant benzoylpyrazol derivatives with herbicidal properties. The problem addressed by the present invention cannot be regarded as that of providing further herbicidally active benzoylpyrazol derivatives because the solution is obvious to a person skilled in the art in the light of D1 and D2.

The problem addressed by the invention must therefore be regarded as that of providing novel derivatives which have unexpected or surprising properties compared with the closest prior art (D1 and D2). Without the results of comparative tests, it is not possible to assess whether the invention meets the requirement of PCT Article 33(3).

		•	t

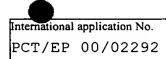
INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.
PCT/EP 00/02292

VII. Cer	tain de	efects in	the int	ernation	al applica	ition	_						
The follow	The following defects in the form or contents of the international application have been noted:												
	-	1					:	- af	DC III	D. l.	E 1/a	\	
							irement te docu			Rule	5.1(a)(11),	
			-										
[
					- '			-					

		•	•
		•	

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT



VIII. Certain observations on the international application

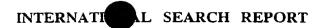
The following observations on the clarity of the claims, description, and drawings or on the question whether the claims are fully supported by the description, are made:

The definition of Z in Claim 1 refers to 1-4 heteroatoms, and then in parentheses specifies up to 4 nitrogen atoms with the optional "addition" (one possibility) of 1 oxygen or 1 sulphur atom. This implies that it is possible to have more than 4 heteroatoms; if this is not the case, the stipulation "alternatively" would suffice (PCT Article 6).

Step (c) in Claim 7 is unclear because the reaction does not seem viable. To obtain the target molecule, H_2 would have to be separated. According to page 54 of the description, the compound should include a Cl-Y group instead of an H-Y group as specified in Claim 7 (PCT Articles 5 and 6).

The subject matter of Claim 8 is already explicitly stated in Claim 1, which indicates that Y can be hydrogen. Claim 8 therefore appears to be redundant.

Since Q is not specified in Claim 1, the reference in Claim 5 seems meaningless.



In a	pplication No
PCT/EP	98/04481

Category '	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
	Onation of Goodmann. With Modelland the September 2011 and September 2011	
X	CHEMICAL ABSTRACTS, vol. 076, no. 15, 1972 Columbus, Ohio, US; abstract no. 085658, SAMULA K: "Condensation of acetylbenzene derivatives with pyridine aldehydes" page 405; column 1; XP002088291 see abstract & ROCZ. CHEM. (ROCHAC);71; VOL.45 (11); PP.1833-40, Inst. Farm.;Warsaw; Pol.	7
X	MIYANO S ET AL: "Nucleophilic addition of phenols to N-(2-pyridylmethylene)aniline" TETRAHEDRON LETT. (TELEAY);70; (22); PP.1909-12, XP002088290 Fukuoka Univ.:Dep. Pharm. Sci.; Fukuoka; Japan see page 1911; table I	7
X	WO 96 26206 A (BASF AG :DEYN WOLFGANG VON (DE); HILL REGINA LUISE (DE); KARDORFF) 29 August 1996 see abstract; claims 1-3,5,6 see page 39 - page 40; table 5	1-11
X	EP 0 282 944 A (NISSAN CHEMICAL IND LTD) 21 September 1988 cited in the application see page 293 - page 295: claim 1 see page 296. line 25 - line 35: claim 2 see page 39: example 31: table 3	1-11

International application No. PCT/EP 98/04481

Box I	Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 1 of first sheet)
This inte	rnational search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:
1.	Claims Nos.: because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:
2. X	Claims Nos.: non applicable because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:
	See the addendum ADDITIONAL MATTER PCT/ISA/210
3.	Claims Nos.: because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).
Box II	Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 2 of first sheet)
This Int	ernational Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:
:	
1.	As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.
2.	As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.
3.	As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
4.	No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:
Barris	The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.
Kemai	No protest accompanied the payment of additional search fees.

Form PCT/ISA/210 (continuation of first sheet (1)) (July 1992)

Claim No: non applicable

The search rests on so large a number of particularly relevant documents related to the subject of Claim 7 (intermediary products in the production of compounds according to Claim 1), especially from the point of view of novelty, that the completion of a comprehensive European search report is impossible. The aforementioned documents should be regarded as documents selected from among those which were found, especially with regard to their significance as to the subject exemplified in the present application.

INTER FIONAL SEARCH REPORT

mormation on patent family members

ational Application No PCT/EP 98/04481

Patent document cited in search report		Publication date		atent family nember(s)	Publication date
FR 2053017	A	16-04-1971	CA CH GB NL US	926409 A 537894 A 1272190 A 7008622 A 3655693 A	15-05-1973 31-07-1973 26-04-1972 29-12-1970 11-04-1972
WO 9626206	Α	29-08-1996	AU BG BR CA CZ EP FI HU LT LV NO PL	4665596 A 101825 A 9607333 A 2210693 A 1175951 A 9702473 A 0811007 A 973471 A 9800725 A 97145 A,B 11895 A 11895 B 973861 A 322277 A	11-09-1996 30-04-1998 25-11-1997 29-08-1996 11-03-1998 13-05-1998 10-12-1997 22-08-1997 28-07-1998 26-01-1998 20-12-1997 20-03-1998 22-10-1997 19-01-1998
EP 0282944	A	21-09-1988	AU AU CA CN DE DK ER JP JP KUUS RO	142624 T 599468 B 1309988 A 1328260 A 1023011 B 3855518 D 3855518 T 146488 A 2094719 T 3021596 T 2000173 A 2725274 B 10095702 A 9604862 B 1836018 A 2055836 C 4948887 A 5175299 A 105806 A	15-09-1996 19-07-1990 15-09-1988 05-04-1994 08-12-1993 17-10-1996 20-02-1997 18-09-1988 01-02-1997 28-02-1997 05-01-1990 11-03-1998 14-04-1998 16-04-1996 23-08-1993 10-03-1996 14-08-1990 29-12-1992 30-12-1992

CHERCHENBERICHT INTERNATIONALER

es Aktenzeichen PCT/EP 98/04481

a. klassifizierung des anmeldungsgegenstandes IPK 6 C07D401/10 A01N43/56 A01N43/40 A01N43/08 A01N43/74 C07D413/10 C07D307/42 C07D307/58 C07D405/10 C07D213/30

C07D261/08

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierter Mindestprufstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole) CO7D A01N IPK 6

Recherchierte aber nicht zum Mindestprufstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Wahrend der internationalen Recherche konsuttierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

Kategorie '	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr
X	FR 2 053 017 A (MERCK AND CO., INC.) 21. Mai 1971 siehe Seite 1 siehe Seite 10 - Seite 22: Beispiele	7
X	BOHLMANN F ET AL: "Synthesis of naturally occuring hydroxyacetophenone derivatives" CHEM. BER. (CHBEAM);72; VOL.105 (3); PP.863-73, XP002088289 Tech. Univ. Berlin;0rgChem. Inst.; Berlin; Ger. siehe Seite 864; Beispiel 9	7

Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu X entnehmen "T" Spatere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verstandnis des der Besondere Kategorien von angegebenen Veroffentlichungen "A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist "E" alteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist "X" Veroffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veroffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit berunend betrachtet werden

Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritatsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden. Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erlindenscher Tätigkeit berühend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

ausgerunn)
"O" Veröffentlichung, die sich auf eine mundliche Offenbarung,
eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht
"P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach
dem beansprüchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist "&" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Absendedatum des internationalen Recherchenberichts

Siehe Anhang Patentfamilie

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

12/01/1999 16. Dezember 1998

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehorde

Europáisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040. Tx. 31 651 epo nl. Fax: (+31-70) 340-3016

Bevolimachtigter Bediensteter

Paisdor, B

Formblatt PCT/ISA/210 (Blatt 2) (Juli 1992)

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
x	CHEMICAL ABSTRACTS, vol. 076, no. 15, 1972 Columbus, Ohio, US; abstract no. 085658, SAMULA K: "Condensation of acetylbenzene derivatives with pyridine aldehydes" Seite 405; Spalte 1; XP002088291 siehe Zusammenfassung & ROCZ. CHEM. (ROCHAC);71; VOL.45 (11); PP.1833-40, Lock Sammen Pol	7
X	Inst. Farm.:Warsaw; Pol MIYANO S ET AL: "Nucleophilic addition of phenols to N-(2-pyridylmethylene)aniline" TETRAHEDRON LETT. (TELEAY);70; (22); PP.1909-12, XP002088290 Fukuoka Univ.;Dep. Pharm. Sci.; Fukuoka: Japan siehe Seite 1911; Tabelle I	7
X	WO 96 26206 A (BASF AG :DEYN WOLFGANG VON (DE); HILL REGINA LUISE (DE); KARDORFF) 29. August 1996 siehe Zusammenfassung; Ansprüche 1-3,5,6 siehe Seite 39 - Seite 40; Tabelle 5	1-11
X	EP 0 282 944 A (NISSAN CHEMICAL IND LTD) 21. September 1988 in der Anmeldung erwähnt siehe Seite 293 - Seite 295: Anspruch 1 siehe Seite 296. Zeile 25 - Zeile 35: Anspruch 2 siehe Seite 39: Beispiel 31: Tabelle 3	1-11

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

...ternationales Aktenzeichen

PCT/EP 98/04481

Feld I Bemerkungen zu den Ansprüchen, die sich als nicht recherchierbar erwiesen haben (Fortsetzung von Punkt 1 auf Bla	1 11 1
Gemaß Artikel 17(2)a) wurde aus folgenden Gründen für bestimmte Ansprüche kein Recherchenbericht erstellt:	
Ansprüche Nr. weil Sie sich auf Gegenstände beziehen, zu deren Recherche die Behörde nicht verpflichtet ist, nämlich	i.
2. X Ansprüche Nr. nicht anwendbar weil sie sich auf Teile der internationalen Anmeldung beziehen, die den vorgeschriebenen Anforderungen so wenig entsprechen, weil sie sich auf Teile der internationalen Anmeldung beziehen, die den vorgeschriebenen Anforderungen so wenig entsprechen, daß eine sinnvolle internationale Recherche nicht durchgeführt werden kann, namlich siehe Zusatzblatt WEITERE ANGABEN PCT/ISA/210	
3. Ansprüche Nr. weil es sich dabei um abhangige Ansprüche handelt, die nicht entsprechend Satz 2 und 3 der Regel 6.4 a) abgefaßt sind.	
Feld II. Bemerkungen bei mangelnder Einheitlichkeit der Erfindung (Fortsetzung von Punkt 2 auf Blatt 1)	
Die internationale Recherchenbehörde hat festgestellt, daß diese internationale Anmeldung mehrere Erfindungen enthält:	
Da der Anmelder alle erforderlichen zusatzlichen Recherchengebuhren rechtzeitig entrichtet hat lerstreckt sich dieser internationalen Anmeldung internationale Recherchenbericht auf alle recherchenbaren Anspruche der internationalen Anmeldung	
Da für alle recherchierbaren Ansprüche die Recherche ohne einen Arbeitsaufwand durchgeführt werden könnte, der eine zusatzliche Recherchengebuhr gerechtfertigt hatte, hat die Internationale Recherchenbehörde nicht zur Zahlung einer solchen Gebuhr aufgefordert.	
Da der Anmelder nur einige der erforderlichen zusätzlichen Recherchengebuhren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich diese internationale Recherchenbericht nur auf die Anspruche der internationalen Anmeldung, für die Gebühren entrichtet worden sind, nämlich auf die Anspruche Nr.	ər
4. Der Anmelder hat die erforderlichen zusatzlichen Recherchengebühren nicht rechtzeitig entrichtet. Der internationale Recherchenbericht beschränkt sich daher auf die in den Ansprüchen zuerst erwähnte Erfindung; diese ist in folgenden Ansprüchen ei faßt:	r-
Bemerkungen hinsichtlich eines Widerspruchs Die zusätzlichen Gebühren wurden vom Anmelder unter Widerspruch ge Die Zahlung zusatzlicher Gebühren erfolgte ohne Widerspruch.	zahlt.

Formblatt PCT/ISA/210 (Fortsetzung von Blatt 1 (1))(Juli 1992)

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen PCT/EP 98 04481

WEITERE ANGABEN	PCT/ISA/	210
Ansprüche Nr.: nicht an	nwendbar	
den Gegenstand des Anspi Verbindungen von Ansprud offenbart, daß die Erst Recherchenberichtes nich Auswahl aus den gefunde	ruches 7 (Zwisc ch 1), speziell ellung eines vo nt möglich ist. nen Dokumenten Bedeutung im Hi	besonders relevanter Dokumente für henprodukte in der Herstellung der im Hinblick auf die Neuheit, Ilständigen Europäischen Die zitierten Dokumente sind als anzusehen, insbesondere unter nblick auf den durch die Beispiele egenden Anmeldung.

INTERNATIONALER REFERENCE REPRESENTATIONALER REPRESENTATIONAL REPR

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehoren

In. S Aktenzeichen
PCT/EP 98/04481

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung		glied(er) der tentfamilie	Datum der Veröffentlichung
FR 2053017 A	16-04-1971	CA CH GB NL US	926409 A 537894 A 1272190 A 7008622 A 3655693 A	15-05-1973 31-07-1973 26-04-1972 29-12-1970 11-04-1972
WO 9626206 A	29-08-1996	AU BG BR CA CZ EP FI HU LV LV NO PL	4665596 A 101825 A 9607333 A 2210693 A 1175951 A 9702473 A 0811007 A 973471 A 9800725 A 97145 A,B 11895 A 11895 B 973861 A 322277 A	11-09-1996 30-04-1998 25-11-1997 29-08-1996 11-03-1998 13-05-1998 10-12-1997 22-08-1997 28-07-1998 26-01-1998 20-12-1997 20-03-1998 22-10-1997 19-01-1998
EP 0282944 A	21-09-1988	AT AU CA CN DE DK ES GP JP KR US RO US	142624 T 599468 B 1309988 A 1328260 A 1023011 B 3855518 D 3855518 T 146488 A 2094719 T 3021596 T 2000173 A 2725274 B 10095702 A 9604862 B 1836018 A 2055836 C 4948887 A 5175299 A 105806 A 4885022 A	15-09-1996 19-07-1990 15-09-1988 05-04-1994 08-12-1993 17-10-1996 20-02-1997 18-09-1988 01-02-1997 28-02-1997 05-01-1990 11-03-1998 14-04-1998 16-04-1996 23-08-1993 10-03-1996 14-08-1990 29-12-1992 30-12-1992 05-12-1989

			•
			ţ
		,	

09/937-631

PCT WELTORGANIS

WELTORGANISATION FÜR GEISTIGES EIGENTUM Internationales Büro

INTERNATIONALE ANMELDUNG VERÖFFENTLICHT NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT)

(51) Internationale Patentklassifikation 7:

C07D 403/10, A01N 43/653, 43/56, C07D 401/10, 417/10, 471/04, 231/20, 413/10, 487/04

(11) Internationale Veröffentlichungsnummer:

WO 00/58306

(43) Internationales

Veröffentlichungsdatum:

5. Oktober 2000 (05.10.00)

(21) Internationales Aktenzeichen:

PCT/EP00/02292

A1

(22) Internationales Annieldedatum:

15. März 2000 (15.03.00)

(30) Prioritätsdaten:

199 14 140.1

27. März 1999 (27.03.99)

DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten ausser US): BAYER AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; D-51368 Leverkusen (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): MÜLLER, Klaus-Helmut [AT/DE]; Solfstr. 19, D-40593 Düsseldorf (DE). LEHR, Stefan [DE/DE]; Ricarda-Huch-Str. 38, D-40764 Langenfeld (DE). SCHALLNER, Otto [DE/DE]; Noldeweg 22, D-40789 Monheim (DE). SCHWARZ, Hans-Georg [DE/DE]; Stettiner Str. 7 a, D-40764 Langenfeld (DE). WROBLOWSKY, Heinz-Jürgen [DE/DE]; Virneburgstr. 73, D-40764 Langenfeld (DE). DREWES, Mark, Wilhelm [DE/DE]; Goethestr. 38, D-40764 Langenfeld (DE). FEUCHT, Dieter [DE/DE]; Ackerweg 9, D-40789 Monheim (DE). PONTZEN, Rolf [DE/DE]; Am Kloster 69, D-42799 Leichlingen (DE). WETCHOLOWSKY, Ingo

[DE/BR]; Cond. Estancia Marambaia, Rua Avare, 500, CEP-13280-000 Vinhedo, SP (BR).

(74) Gemeinsamer Vertreter: BAYER AKTIENGE-SELLSCHAFT; D-51368 Leverkusen (DE).

(81) Bestimmungsstaaten: AE, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TF, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW, ARIPO Patent (GH, GM, KE, LS, MW, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht

Mit internationalem Recherchenbericht. Vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche zugelassenen Frist; Veröffentlichung wird wiederholt falls Änderungen eintreffen.

- (54) Title: SUBSTITUTED BENZOYLPYRAZOLES AS HERBICIDES
- (54) Bezeichnung: SUBSTITUIERTE BENZOYLPYRAZOLE ALS HERBIZIDE

(57) Abstract

The invention relates to novel substituted benzoylpyrazoles of the general formula (I), in which Z is a possibly substituted 4 to 12-membered, saturated or unsaturated. monocyclic or bicyclic heterocyclic grouping which contains between 1 and 4 heteroatoms (up to 4 nitrogen atoms and possibly, either in addition or alternatively, an oxygen atom or a sulphur atom or an SO grouping or an SO₂ grouping) and in addition contains between one and three

$$\begin{array}{c|c}
R^{2} & O \\
N & A \\
R^{1} & R^{3}
\end{array}$$
(I)

oxo-groups (C=O) and/or thioxo-groups (C=S) as components of the heterocyclic compound. The invention also relates to a method of producing said benzoylpyrazoles and to their use as herbicides.

(57) Zusammenfassung

Die Erfindung betrifft neue substituierte Benzoylpyrazole der allgemeinen Formel (I), in welcher Z für eine gegebenenfalls substituierte 4- bis 12-gliedrige, gesättigte oder ungesättigte, monocyclische oder bicyclische, heterocyclische Gruppierung steht, welche I bis 4 Heteroatome (bis zu 4 Stickstoffatome und gegebenenfall – salternativ oder additiv – ein Sauerstoffatom oder ein Schwefelatom, oder eine SO-Gruppierung oder eine SO2-Gruppierung) enthält, und welche zusätzlich ein bis drei Oxo-Gruppen (C=O) und/oder Thioxo-Gruppen (C=S) als Bestandteile des Heterocyclus enthält, sowie Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Herbizide.

LEDIGLICH ZUR INFORMATION

Codes zur Identifizierung von PCT-Vertragsstaaten auf den Kopfbögen der Schriften, die internationale Anmeldungen gemäss dem PCT veröffentlichen.

AL	Albanien	ES	Spanien	LS	Lesotho	Sī	Slowenien
AM	Armenien	FI	Finnland	LT	Litauen	SK	Slowakei
AT	Österreich	FR	Frankreich	LU	Luxemburg	SN	Senegal
AU	Australien	GA	Gabun	LV	Lenland	SZ	Swasiland
AZ	Aserbaidschan	GB	Vereinigtes Königreich	MC	Monaco	TD	Tschad
BA	Bosnien-Herzegowina	GE	Georgien	MD	Republik Moldau	TG	Togo
BB	Barbados	GH	Ghana	MG	Madagaskar	TJ	Tadschikistan
BE	Belgien	GN	Guinea	MK	Die ehemalige jugoslawische	TM	Turkmenistan
BF	Burkina Faso	GR	Griechenland		Republik Mazedonien	TR	Türkei
BG	Bulgarien	HU	Ungarn	ML	Mali	TT	Trinidad und Tobago
BJ	Benin	IE	Irland	MN	Mongolei	UA	Ukraine
BR	Brasilien	IL	Israel	MR	Mauretanien	UG	Uganda
BY	Belarus	15	Island	MW	Malawi	US	Vereinigte Staaten von
CA	Kanada	IT	Italien	MX	Mexiko		Amerika
CF	Zentralafrikanische Republik	JР	Japan	NE	Niger	ŲΖ	Usbekistan
CG	Kongo	KE	Kenia	NL	Niederlande	VN	Vietnam
CH	Schweiz	KG	Kirgisistan	NO	Norwegen	YU	Jugoslawien
CI	Côte d'Ivoire	KP	Demokratische Volksrepublik	NZ	Neuseeland	zw	Zimbabwe
CM	Kamerun		Korea	PL	Polen		
CN	China	KR	Republik Korea	PΓ	Portugal		
CU	Kuba	ΚŻ	Kasachstan	RO	Rumänien		
CZ	Tschechische Republik	LC	St. Lucia	RU	Russische Föderation		
DE	Deutschland	LI	Liechtenstein	SD	Sudan		
DK	Dänemark	LK	Sri Lanka	SE	Schweden		
EE	Estland	LR	Liberia	SG	Singapur		

SUBSTITUIERTE BENZOYLPYRAZOLE ALS HERBIZIDE

Die Erfindung betrifft neue substituierte Benzoylpyrazole, Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Herbizide.

Es ist bereits bekannt, dass bestimmte substituierte Benzoylpyrazole herbizide Eigenschaften aufweisen (vgl. EP-A-352543, WO-A-96/26206, WO-A-97/35850, WO-A-97/41105, WO-A-97/41116, WO-A-97/41117, WO-A-97/41118, WO-A-97/46530, WO-A-98/28981, WO-A-98/31681, WO-A-98/31682, WO-A-99/07697). Die Wirkung dieser Verbindungen ist jedoch nicht in allen Belangen zufriedenstellend.

Es wurden nun die neuen substituierten Benzoylpyrazole der allgemeinen Formel (I),

15

5

10

in welcher

- n für die Zahlen 0, 1, 2 oder 3 steht,
- 20 A für eine Einfachbindung oder für Alkandiyl (Alkylen) steht,
 - R¹ für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkinyl oder Cycloalkyl steht,
- 25 R² für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkoxy. Alkylthio. Alkoxy-carbonyl oder Cycloalkyl steht.

R³ für Wasserstoff, Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylamino, Dialkylamino oder Dialkylaminosulfonyl steht,

5

10 '

- R⁴ für Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylamino, Dialkylamino oder Dialkylaminosulfonyl steht,
- Y für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxycarbonyl, Alkylsulfonyl, Alkylaminocarbonyl, Dialkylaminocarbonyl, Alkenyl, Alkenylcarbonyl, Alkenylsulfonyl, Alkinyl,
 Alkinylcarbonyl, Cycloalkyl, Cycloalkylcarbonyl, Cycloalkylalkyl, Phenylcarbonyl, Phenylsulfonyl, Phenylalkyl oder Phenylcarbonylalkyl steht, und
 - Z für eine gegebenenfalls substituierte 4- bis 12-gliedrige, gesättigte oder ungesättigte, monocyclische oder bicyclische, heterocyclische Gruppierung steht, welche 1 bis 4 Heteroatome (bis zu 4 Stickstoffatome und gegebenenfalls alternativ oder additiv ein Sauerstoffatom oder ein Schwefelatom, oder eine SO-Gruppierung oder eine SO2-Gruppierung) enthält, und welche zusätzlich ein bis drei Oxo-Gruppen (C=O) und/oder Thioxo-Gruppen (C=S) als Bestandteile des Heterocyclus enthält,
- einschließlich aller möglichen tautomeren Formen der Verbindungen der allgemeinen Formel (I) und der möglichen Salze der Verbindungen der allgemeinen Formel (I) gefunden.
- In den Definitionen sind die Kohlenwasserstoffketten, wie Alkyl oder Alkandiyl

 auch in Verbindung mit Heteroatomen, wie in Alkoxy jeweils geradkettig oder verzweigt.

5

10

15

20

- n steht bevorzugt für die Zahlen 0, 1 oder 2.
- A steht bevorzugt für eine Einfachbindung oder für Alkandiyl (Alkylen) mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen.

R1 steht bevorzugt für gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Halogen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkyl-carbonyl, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfinyl oder C₁-C₄-Alkylsulfonyl substituiertes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl substituiertes Alkenyl oder Alkinyl mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen, oder für

gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Halogen, C1-C4-Alkyl

oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlen-

stoffatomen.

R² steht bevorzugt für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkoxy oder Alkoxycarbonyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen, für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkylthio mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, oder für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkyl substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen.

steht bevorzugt für Wasserstoff, Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₄Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfinyl oder C₁-C₄-Alkylsulfonyl
substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit
jeweils bis zu 4 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, oder für Alkylamino, Dialkylamino oder Dialkylaminosulfonyl mit jeweils bis zu 4 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen.

R⁴

5

steht bevorzugt für Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfinyl oder C₁-C₄-Alkylsulfonyl substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils bis zu 4 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, oder für Alkylamino, Dialkylamino oder Dialkylaminosulfonyl mit jeweils bis zu 4 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen.

steht bevorzugt für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Y 10 Carboxy, Carbamoyl, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxycarbonyl substituiertes Alkyl, Alkylcarbonyl oder Alkoxycarbonyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkylsulfonyl, Alkylaminocarbonyl oder Dialkylaminocarbonyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch 15 Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl substituiertes Alkenyl, Alkenylcarbonyl, Alkinyl oder Alkinylcarbonyl mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen, für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkenylsulfonyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C1-C4-Alkyl substituiertes Cycloalkyl, Cyclo-20 alkylcarbonyl oder Cycloalkylalkyl mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Cycloalkylgruppen und gegebenenfalls 1 bis 3 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, oder für jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy substituiertes Phenylcarbonyl, Phenylsulfonyl, Phenyl-25 C_1 - C_4 -alkyl oder Phenylcarbonyl- C_1 - C_4 -alkyl.

Z steht bevorzugt für eine der nachstehenden heterocyclischen Gruppierungen

$$Q \longrightarrow R^{5} \qquad Q \longrightarrow Q$$

$$Q \longrightarrow Q$$

worin jeweils die gestrichelt gezeichnete Bindung eine Einfachbindung oder eine Doppelbindung ist,

Q für Sauerstoff oder Schwefel steht,

10

 R^5

5

für Wasserstoff, Hydroxy, Mercapto, Cyano, Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen, C1-C4-Alkoxy, C1-C4-Alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfinyl oder C₁-C₄-Alkylsulfonyl substituiertes Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxy, Alkoxycarbonyl, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, für Propadienylthio, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkylamino oder Dialkylamino mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkenyl, Alkinyl, Alkenyloxy, Alkenylthio oder Alkenylamino mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen in den Alkenyl- bzw. Alkinylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Cycloalkyl, Cycloalkyloxy, Cycloalkylthio, Cycloalkylamino, Cycloalkylalkyl, Cycloalkylalkoxy, Cycloalkylalkylthio oder Cycloalkylalkylamino mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Cycloalkylgruppen und gegebenenfalls bis zu 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, für jeweils gegebenen-

20

R6

falls durch Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Phenyl, Phenyloxy, Phenylthio, Phenylamino, Benzyl, Benzyloxy, Benzylthio oder Benzylamino steht, für Pyrrolidino, Piperidino oder Morpholino steht, oder - für den Fall, dass zwei benachbarte Reste R⁵ und R⁵ sich an einer Doppelbindung befinden - zusammen mit dem benachbarten Rest R⁵ auch für eine Benzogruppierung steht, und

für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, Alkylidenamino mit bis zu 4

Kohlenstoffatomen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen oder

C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylamino, Dialkylamino oder Alkanoylamino mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen in

5

10

15

20

25

den Alkylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkenyl, Alkinyl oder Alkenyloxy mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen in den Alkenyl- bzw. Alkinylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl oder Cycloalkylamino mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Cycloalkylgruppen und gegebenenfalls bis zu 3 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, C1-C4-Alkyl oder C1-C4-Alkoxy substituiertes Phenyl oder Benzyl steht, oder zusammen mit einem benachbarten Rest R⁵ oder R⁶ für gegebenenfalls durch Halogen oder C1-C4-Alkyl substituiertes Alkandiyl mit 3 bis 5 Kohlenstoffatomen steht,

wobei die einzelnen Reste R⁵ und R⁶ - soweit mehrere davon an gleiche heterocyclische Gruppierungen gebunden sind, gleiche oder verschiedene Bedeutungen im Rahmen der obigen Definition haben können.

- Q steht bevorzugt für Sauerstoff.
- 30 R⁵ steht bevorzugt für Wasserstoff, Hydroxy, Mercapto, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Iod, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor,

Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, n-, i-, s- oder t-Butylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl substituiertes Methyl, Ethyl, noder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, n-, i-, s- oder t-Butylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, noder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, für Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, n-, i-, s- oder t-Butylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Di-n-propylamino oder Di-i-propylamino, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Ethenyl, Propenyl, Butenyl, Ethinyl, Propinyl, Butinyl, Propenyloxy, Butenyloxy, Propenylthio, Butenylthio, Propenylamino oder Butenylamino, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopropyloxy, Cyclobutyloxy, Cyclopentyloxy, Cyclohexyloxy, Cyclopropylthio, Cyclobutylthio, Cyclopentylthio, Cyclohexylthio, Cyclopropylamino, Cyclobutylamino, Cyclopentylamino, Cyclohexylamino, Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl, Cyclohexylmethyl, Cyclopropylmethoxy, Cyclobutylmethoxy, Cyclopentylmethoxy, Cyclohexyl-Cyclopropylmethylthio, Cyclobutylmethylthio, Cyclomethoxy. pentylmethylthio, Cyclohexylmethylthio, Cyclopropylmethylamino. Cyclobutylmethylamino, Cyclopentylmethylamino oder Cyclohexylmethylamino, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, noder i-Propoxy substituiertes Phenyl, Phenyloxy, Phenylthio, Phenylamino, Benzyl. Benzyloxv. Benzylthio oder Benzylamino, für Pyrrolidino, Piperidino oder Morpholino steht, oder - für den Fall. dass zwei benachbarte Reste R⁵ und R⁵ sich an einer Doppelbindung

5

10

15

20

25

befinden - zusammen mit dem benachbarten Rest \mathbb{R}^5 auch für eine Benzogruppierung.

R6 steht bevorzugt für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor, Methoxy oder Ethoxy substitu-5 iertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i- oder s-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylamino, Ethylamino oder Dimethylamino, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Ethenyl, Propenyl, Ethinyl, Propinyl oder Propenyloxy, für 10 jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl, Cyclohexylmethyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, noder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-15 Propoxy substituiertes Phenyl oder Benzyl steht, oder zusammen mit einem benachbarten Rest R⁵ oder R⁶ für jeweils gegebenenfalls durch Methyl und/oder Ethyl substituiertes Propan-1,3-diyl (Trimethylen), Butan-1,4-diyl (Tetramethylen) oder Pentan-1,5-diyl (Pentamethylen).

- 20 n steht besonders bevorzugt für die Zahlen 0 oder 1.
 - A steht besonders bevorzugt für eine Einfachbindung, Methylen. Ethyliden (Ethan-1,1-diyl) oder Dimethylen (Ethan-1,2-diyl).
- steht besonders bevorzugt für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Propenyl, Butenyl, Propinyl oder Butinyl, oder für

 R^3

15

20

25

30

jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Ethyl substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl.

PCT/EP00/02292

steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy
oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder tButyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor
und/oder Chlor substituiertes Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, oder
für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder
Ethyl substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl.

steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, Iod, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, oder für Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Dimethylaminosulfonyl oder Diethylaminosulfonyl.

R4 steht besonders bevorzugt für Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thio-carbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy. Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-

Butyl, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, oder für Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Dimethylaminosulfonyl, oder Diethylaminosulfonyl.

R5

5

10

15

steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Hydroxy, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Difluormethyl, Dichlormethyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Chlordifluormethyl, Fluordichlormethyl, Fluorethyl, Chlorethyl, Difluorethyl, Dichlorethyl, Fluor-n-propyl, Fluor-ipropyl, Chlor-n-propyl, Chlor-i-propyl, Methoxymethyl, Ethoxymethyl, Methoxyethyl, Ethoxyethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, soder t-Butoxy, Fluorethoxy, Chlorethoxy, Difluorethoxy, Dichlorethoxy, Trifluorethoxy, Trichlorethoxy, Chlorfluorethoxy, Chlordifluorethoxy, Fluordichlorethoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Fluorethylthio, Chlorethylthio, Difluorethylthio, Dichlorethylthio, Chlorfluorethylthio, Chlordifluorethylthio, Fluordichlorethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, noder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, Dimethylamino, Propenylthio, Butenylthio, Propinylthio, Butinylthio, Cyclopropyl, Cyclopropylmethyl, Cyclopropylmethoxy, Phenyl oder Phenoxy.

20

25

steht besonders bevorzugt für Amino, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, Methylamino, Dimethylamino, Cyclopropyl oder Cyclopropylmethyl steht, oder zusammen mit R⁵ für Propan-1,3-diyl (Trimethylen), Butan-1,4-diyl (Tetramethylen) oder Pentan-1,5-diyl (Pentamethylen).

steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, noder i-Propyl, Acetyl, Propionyl, n- oder i-Butyroyl, Methoxycarbonyl oder Ethoxycarbonyl, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor und/oder Brom substituiertes Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, n-, i-, s- oder t-Butylsulfonyl, Methylaminocarbonyl, Ethylaminocarbonyl, noder i-Propylaminocarbonyl, Dimethylaminocarbonyl oder Diethylaminocarbonyl, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Propenyl, Butenyl, Propenylcarbonyl, Butenylcarbonyl, Propenylsulfonyl, Butenylsulfonyl, Propinyl, Butinyl, Propinylcarbonyl oder Butinylcarbonyl, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methyl oder Ethyl substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopropylcarbonyl, Cyclobutylcarbonyl, Cyclopentylcarbonyl, Cyclohexylcarbonyl, Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl oder Cyclohexylmethyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Difluormethoxy oder Trifluormethoxy substituiertes Phenylcarbonyl, Phenylsulfonyl, Benzyl oder Phenylcarbonylmethyl.

20

15

Y

5

10

Z steht besonders bevorzugt für

25 n steht ganz besonders bevorzugt für 0.

A steht ganz besonders bevorzugt für eine Einfachbindung oder für Methylen.

5

10

15

25

R1 steht ganz besonders bevorzugt für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, oder für gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Ethyl substituiertes Cyclopropyl.

steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, oder für Cyclopropyl.

steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Methoxymethyl, Methylsthiomethyl, Methylsulfinylmethyl, Methylsulfonylmethyl, Methoxy, Ethoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfonyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl oder Dimethylaminosulfonyl.

20 R⁴ steht besonders bevorzugt für Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Methoxymethyl, Methylthiomethyl, Methylsulfinylmethyl, Methylsulfonylmethyl, Methoxy, Ethoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, Dimethylamino oder Dimethylaminosulfonyl.

R6 steht ganz besonders bevorzugt für Methyl, Cyclopropyl, Dimethylamino, Methoxy oder Ethoxy.

Y steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff.

A steht am meisten bevorzugt für Methylen.

5

20

- R1 steht am meisten bevorzugt für Methyl oder Ethyl.
- R² steht am meisten bevorzugt für Wasserstoff oder Methyl.
- R³ steht am meisten bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Trifluormethyl oder Methylsulfonyl.
- 10

 R⁴ steht am meisten bevorzugt für (2-)Chlor, (4-)Chlor, (6-)Trifluormethyl oder (2-)Methylsulfonyl.
- Erfindungsgemäß bevorzugt sind die Verbindungen der Formel (I), in welchen eine Kombination der vorstehend als bevorzugt aufgeführten Bedeutungen vorliegt.

Erfindungsgemäß besonders bevorzugt sind die Verbindungen der Formel (I), in welchen eine Kombination der vorstehend als besonders bevorzugt aufgeführten Bedeutungen vorliegt.

- Erfindungsgemäß ganz besonders bevorzugt sind die Verbindungen der Formel (I), in welchen eine Kombination der vorstehend als ganz besonders bevorzugt aufgeführten Bedeutungen vorliegt.
- Erfindungsgemäß am meisten bevorzugt sind die Verbindungen der Formel (I). in welchen eine Kombination der vorstehend als am meisten bevorzugt aufgeführten Bedeutungen vorliegt.

5

Die Verbindungen der allgemeinen Formeln (IA), (IB) und (IC) sind insbesondere Gegenstand der vorliegenen Erfindung:

10

$$R^{1}$$
 N
 R^{2}
 R^{4}
 N
 N
 N
 N
 R^{5}
 R^{5}
 R^{5}
 R^{5}
 R^{5}

in welchen

n, A, Q, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ und Y die vorausstehend angegebene Bedeutung haben.

Gegenstand der Erfindung sind vorzugsweise auch Natrium-, Kalium-, Magnesium-, Calcium-, Ammonium-, C_1 - C_4 -Alkyl-ammonium-, Di-(C_1 - C_4 -alkyl)-ammonium-, Tri-(C_1 - C_4 -alkyl)-ammonium-, Tetra-(C_1 - C_4 -alkyl)-ammonium-, Tri-(C_1 - C_4 -alkyl)-sulfonium-, C_5 - oder C_6 -Cycloalkyl-ammonium- und Di-(C_1 - C_2 -alkyl)-benzyl-ammonium-Salze von Verbindungen der Formel (I), in welcher n, A, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 . Y und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben.

Die oben aufgeführten allgemeinen oder in Vorzugsbereichen aufgeführten Restedefinitionen gelten sowohl für die Endprodukte der Formel (I) als auch entsprechend für die jeweils zur Herstellung benötigten Ausgangs- oder Zwischenprodukte. Diese Restedefinitionen können untereinander, also auch zwischen den angegebenen bevorzugten Bereichen beliebig kombiniert werden.

Beispiele für die erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (1) sind in den nachstehenden Gruppen aufgeführt.

Gruppe 1

5

10

15

20

$$H_3C-N$$
 H
 O
 O
 N
 N
 N
 N
 R^6
 R^5
 $(IA-1)$

R³, (R⁴)_n, R⁵ und R⁶ haben hierbei beispielhaft die in der nachstehenden Tabelle angegebenen Bedeutungen:

WO 00/58306 PCT/EP00/02292

	(Position-)		
\mathbb{R}^3	$(R^4)_n$	R ⁵	R ⁶
Н	-	CF ₃	CH ₃
F	-	CF ₃	CH ₃
Cl	-	CF ₃	CH ₃
Br	-	CF ₃	CH ₃
I	-	CF ₃	CH ₃
NO ₂	-	CF ₃	CH ₃
CN	-	CF ₃	CH ₃
CH ₃	-	CF ₃	CH ₃
OCH ₃	-	CF ₃	CH ₃
CF ₃	_	CF ₃	CH ₃
OCHF ₂	_	CF ₃	CH ₃
OCF ₃	-	CF ₃	CH ₃
SO ₂ CH ₃	-	CF ₃	CH ₃
Н	-	OCH ₃	CH ₃
F	-	OCH ₃	CH ₃
Cl	-	OCH ₃	CH ₃
Br	-	OCH ₃	CH ₃
I	-	OCH ₃	CH ₃
NO ₂	-	OCH ₃	CH ₃
CN	-	OCH ₃	CH ₃
CH ₃	-	OCH ₃	CH ₃
OCH ₃	-	OCH ₃	CH ₃
CF ₃	-	OCH ₃	CH ₃
OCHF ₂	-	OCH ₃	CH,

	(Position-)		
R ³	(R ⁴) _n	R ⁵	R ⁶
OCF ₃	-	OCH ₃	CH ₃
SO ₂ CH ₃	-	OCH ₃	CH ₃
Н	-	SCH ₃	CH ₃
F	-	SCH ₃	CH ₃
CI	-	SCH ₃	CH ₃
Br	-	SCH ₃	СН3
I	-	SCH ₃	CH ₃
NO ₂	-	SCH ₃	CH ₃
CN	-	SCH ₃	CH ₃
CH ₃	-	SCH ₃	CH ₃
OCH ₃	-	SCH ₃	CH ₃
CF ₃	-	SCH ₃	CH ₃
OCHF ₂	-	SCH ₃	CH ₃
OCF ₃	-	SCH ₃	CH ₃
SO₂CH₃	_	SCH ₃	CH ₃
Н	-	OC₂H,	CH ₃
F	-	OC ₂ H ₅	CH ₃
Cl	-	OC ₂ H ₅	CH ₃
Br	-	OC ₂ H ₅	CH ₃
I	-	OC ₂ H ₅	CH ₃
NO ₂	-	OC ₂ H ₅	CH ₃
CN	-	OC ₂ H ₅	CH ₃
CH ₃	-	OC ₂ H ₅	CH ₃
OCH ₃	-	OC ₂ H ₅	CH,
CF ₃	-	OC ₂ H ₅	CH ₃

	(Position-)		
R ³	$(R^4)_n$	R ⁵	R^6
OCHF ₂	-	OC ₂ H ₅	CH ₃
OCF ₃	-	OC ₂ H ₅	CH ₃
SO ₂ CH ₃	-	OC ₂ H ₅	CH ₃
Н	-	N(CH ₃) ₂	CH ₃
F	-	N(CH ₃) ₂	CH ₃
CI	-	N(CH ₃) ₂	СН,
Br	-	N(CH ₃) ₂	CH ₃
I	-	N(CH ₃) ₂	CH ₃
NO ₂	-	N(CH ₃) ₂	CH ₃
CN	-	N(CH ₃) ₂	CH ₃
CH ₃	-	N(CH ₃) ₂	CH ₃
OCH ₃	-	N(CH ₃) ₂	CH ₃
CF ₃	-	N(CH ₃) ₂	CH ₃
OCHF ₂	-	N(CH ₃) ₂	CH ₃
OCF ₃	-	N(CH ₃) ₂	CH ₃
SO ₂ CH ₃	-	N(CH ₃) ₂	CH ₃
Н	-	OCH ₃	
F	-	OCH ₃	\triangle
Cl	-	OCH ₃	
Br	-	OCH ₃	

	(Position-)		
R ³	$(R^4)_n$	R ⁵	R ⁶
I	-	OCH ₃	\triangle
NO ₂	-	OCH ₃	\triangle
CN	-	OCH ₃	\triangle
CH ₃	-	OCH ₃	\triangle
OCH ₃	-	OCH ₃	\triangle
CF ₃	-	OCH ₃	\triangle
OCHF ₂	-	OCH ₃	\triangle
OCF ₃	-	OCH ₃	\triangle
SO ₂ CH ₃	-	OCH ₃	\triangle
Н	(5-) Cl	CF ₃	CH ₃
F	(5-) CI	CH ₃	CH ₃
Cl	(5-) Cl	OCH ₃	CH ₃
Br	(5-) CI	Br	
CI	(5-) Cl	CF ₃	CH,
NO ₂	(5-) Cl	CH ₃	CH,
CI	(5-) CI	SCH,	СН

	(Position-)		
R ³	$(R^4)_n$	R ⁵	R ⁶
CH ₃	(5-) Cl	Cl	CH ₃
OCH ₃	(5-) Cl	OCH ₃	CH ₃
CF ₃	(5-) Cl	CF ₃	CH ₃
OCHF ₂	(5-) CI	CH ₃	CH ₃
OCF ₃	(5-) Cl	CH ₃	CH ₃
SO ₂ CH ₃	(5-) Cl	OCH ₃	CH ₃

Gruppe 2

$$H_5C_2$$
 H
 O
 N
 N
 N
 R^6
 R^5
 $(IA-2)$

5

R³, (R⁴)_n, R⁵ und R⁶ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegenenen Bedeutungen.

Gruppe 3

$$H_3C-N$$
 CH_3
 N
 N
 N
 R^6
 R^5
(IA-3)

R³, (R⁴)_n, R⁵ und R⁶ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe I angegenenen Bedeutungen.

Gruppe 4

10

R³, (R⁴)_n, R⁵ und R⁶ haben hierbei beispielhaft die in der nachstehenden Tabelle angegenenen Bedeutungen:

	(Position-)		
\mathbb{R}^3	(R ⁴) ₀	R ⁵	R°
CI	(2-) Cl	CF ₃	CH ₃
Cl	(2-) Cl	SCH ₃	CH ₃
Cl	(2-) Cl	SC ₂ H ₅	CH ₃
CI	(2-) Cl	SC ₃ H ₇	CH ₃

	(Position-)		
R ³	(R ⁴) _n	R ⁵	R ⁶
Cl	(2-) Cl	SC ₃ H ₇ -i	CH ₃
CI	(2-) Cl	s	CH ₃
Cl	(2-) Cl	s	CH ₃
CI	(2-) Cl	s	CH ₃
Cl	(2-) CI	s	СН ₃
CI	(2-) CI	s	CH ₃
Cl	(2-) Cl	SCH=C=CH ₂	CH ₃
Cl	(2-) CI	SCH ₂ CN	CH ₃
Cl	(2-) CI	SCH ₂ CH ₂ CN	CH ₃
Cl	(2-) Cl	OCH ₃	CH ₃
Cl	(2-) Cl	OC ₂ H ₅	CH ₃
Cl	(2-) Cl	OC ₃ H ₇	CH ₃
Cl	(2-) CI	OC ₃ H ₇ -i	CH ₃
Cl	(2-) Cl	OC₄H ₉	CH ₃
Cl	(2-) Cl	OCH ₂ CF ₃	CH ₃
CI	(2-) CI		СН,
Cl	(2-) Cl	OC ₆ H ₅	CH ₃

	(Position-)		
R³	$(R^4)_n$	R ⁵	R ⁶
Cl	(2-) Cl	Н	CH ₃
Cl	(2-) Cl	CH ₃	CH ₃
Cl	(2-) Cl	C ₂ H ₅	CH ₃
Cl	(2-) Cl	C ₃ H ₇	CH ₃
Cl	(2-) Cl	C₃H₁-i	CH ₃
Cl	(2-) Cl	C ₄ H ₉	CH ₃
Cl	(2-) Cl	C₄H ₉ -i	CH ₃
Cl	(2-) Cl	C₄H ₉ -s	CH ₃
Cl	(2-) Cl	C₄H ₉ -t	CH ₃
Cl	(2-) CI	\triangle	СН,
Cl	(2-) Cl	\bigcirc	CH ₃
CI	(2-) Cl	CH=CHCH ₃	CH ₃
CI	(2-) CI		CH ₃
CI	(2-) Cl	CI	CH ₃
Cl	(2-) Cl		CH ₃
CI	(2-) Cl	$N(CH_3)_2$	CH ₃
Cl	(2-) Cl	N	CH ₃
Cl	(2-) Cl	Cl	CH ₃
Cl	(2-) CI	Br	CH ₃
SO ₂ CH;	(2-) Cl	CF ₃	CH ₃

	(Position-)		1
\mathbb{R}^3	$(R^4)_n$	R ⁵	R ⁶
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	SCH ₃	CH ₃
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	SC ₂ H ₅	
			CH ₃
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	SC ₃ H ₇	CH ₃
SO₂CH₃	(2-) Cl	SC₃H₁-i	CH ₃
SO ₂ CH ₃	(2-) CI	s	CH ₃
SO ₂ CH ₃	(2-) CI	s	CH ₃
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	s	CH ₃
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	s	CH ₃
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	s	CH ₃
SO ₂ CH ₃	(2-) CI	SCH=C=CH ₂	CH ₃
SO ₂ CH ₃	(2-) CI	SCH ₂ CN	CH ₃
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	SCH ₂ CH ₂ CN	CH ₃
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	OCH ₃	CH ₃
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	OC ₂ H ₅	CH ₃
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	OC ₃ H ₇	CH ₃
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	OC ₃ H ₇ -i	CH ₃
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	OC₄H₀	CH ₃
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	OCH ₂ CF,	CH ₃

	(Position-)		
\mathbb{R}^3	$(R^4)_n$	R ⁵	R ⁶
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	∇	CH ₃
		0	
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	OC ₆ H ₅	CH ₃
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	Н	CH ₃
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	CH ₃	CH ₃
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	C ₂ H ₅	CH ₃
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	C ₃ H ₇	CH ₃
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	C ₃ H ₇ -i	CH ₃
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	C ₄ H ₉	CH ₃
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	C ₄ H ₉ -i	CH ₃
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	C ₄ H ₉ -s	CH ₃
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	C₄H₀-t	CH ₃
SO ₂ CH ₃	(2-) CI		CH ₃
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl		CH ₃
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	CH=CHCH ₃	CH ₃
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl		CH ₃
	ļ		
30.64	(5.) (1		CI CH ₃
SO ₂ CH ₃	(2-) CI		OI CITS
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl		CH ₃
	(2.) (2)	NICH	CH ₃
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	N(CH ₃) ₂	Cr ₁₃

	(Position-)		
R ³	(R⁴) _n	R ⁵	R ⁶
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	\\\ \rightarrow\{\	CH ₃
		N	
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	Cl	CH ₃
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	Br	CH ₃
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₃
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	SCH ₃	CH ₃
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	SC ₂ H ₅	CH ₃
CI	(2-) SO ₂ CH ₃	SC ₃ H ₇	CH ₃
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	SC ₃ H ₇ -i	CH ₃
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃		CH ₃
		s	
CI	(2-) SO ₂ CH ₃		CH ₃
		s	
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃		CH ₃
Cl	(2) 60 611	8	
CI	(2-) SO ₂ CH ₃		CH ₃
Cl	(2) 80 011	`S´	
Ci	(2-) SO ₂ CH ₃		CH ₃
		s	
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	SCH=C=CH,	CH;
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	SCH ₂ CN	CH;
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	SCH ₂ CH ₂ CN	CH;
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	OCH,	CH ₃
			C113

	(Position-)		
R ³	$(\mathbb{R}^4)_n$	R ⁵	R ⁶
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	OC ₂ H ₅	CH ₃
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	OC ₃ H ₇	CH ₃
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	OC ₃ H ₇ -i	CH ₃
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	OC ₄ H ₉	CH ₃
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	OCH ₂ CF ₃	CH ₃
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃		CH ₃
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	OC ₆ H ₅	CH ₃
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	H	CH ₃
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	C_3H_7	CH ₃
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	C ₃ H ₇ -i	CH ₃
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	C₄H ₉	CH ₃
CI	(2-) SO ₂ CH ₃	C₄H ₉ -i	CH ₃
CI	(2-) SO ₂ CH ₃	C ₄ H ₉ -s	CH ₃
CI	(2-) SO ₂ CH ₃	C ₄ H ₉ -t	CH ₃
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	\triangle	CH ₃
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃		CH ₃
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	CH=CHCH ₃	CH ₃
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃		СН,
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃		CI CH,

	(Position-)		
\mathbb{R}^3	(R ⁴) _n	R ⁵	R ⁶
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃		СН3
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	$N(CH_3)_2$	CH ₃
CI	(2-) SO ₂ CH ₃	N	CH ₃
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	Cl	CH ₃
CI	(2-) SO ₂ CH ₃	Br	CH ₃
Cl	(2-) Cl	CF ₃	\triangle
Cl	(2-) Cl	SCH ₃	\triangle
Cl	(2-) Cl	SC ₂ H ₅	\triangle
CI	(2-) CI	SC₃H₁	\triangle
CI	(2-) Cl	SC₃H₁-i	\triangle
CI	(2-) CI	s	\triangle
Cl	(2-) Cl	S	\triangle
Cl	(2-) CI	s	\triangle

	(Position-)		T
\mathbb{R}^3	$(R^4)_n$	R ⁵	R ⁶
Čl	(2-) Cl	s	
CI	(2-) Cl	s	
Cl	(2-) Cl	SCH=C=CH ₂	\triangle
Cl	(2-) Cl	SCH ₂ CN	
Cl	(2-) Cl	SCH ₂ CH ₂ CN	\triangle
Cl	(2-) CI	OCH ₃	\triangle
Cl	(2-) Cl	OC ₂ H ₅	\triangle
Cl	(2-) Cl	OC ₃ H ₇	
Cl	(2-) CI	OC ₃ H ₇ -i	
CI	(2-) Cl	OC₄H,	
Cl	(2-) Cl	OCH ₂ CF ₃	
CI	(2-) CI		

.

	(Position-)		
R ³	(R ⁴) ₀	R ⁵	R ⁶
Cl	(2-) Cl	OC ₆ H ₅	
CI	(2-) Cl	Н	
Cl	(2-) Cl	CH ₃	
CI	(2-) CI	C ₂ H ₅	
CI	(2-) Cl	C ₃ H ₇	
CI	(2-) Cl	C ₃ H ₇ -i	
Cl	(2-) Cl	C ₄ H ₉	
Cl	(2-) Cl	C₄H ₉ -i	
Cl	(2-) Cl	C₄H ₉ -s	
Cl	(2-) CI	C₄H₀-t	
Cl	(2-) CI		
CI	(2-) Cl		
Cl	(2-) CI	СН=СНСН,	

	(Position-)		
R ³	(R ⁴) _n	R ⁵	R ⁶
Cl	(2-) Cl		
Cl	(2-) Cl	CI	
Cl	(2-) Cl		\triangle
Cl	(2-) Cl	N(CH ₃) ₂	
CI	(2-) Cl	N	
Cl se	(2-) CI	Cl	
Cl	(2-) Cl	Br	\triangle
SO ₂ CH ₃	(2-) CI	CF ₃	
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	SCH ₃	
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	SC ₂ H ₅	
SO ₂ CH ₃	(2-) CI	SC ₃ H ₇	
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	SC ₃ H ₇ -i	

	100		
	(Position-)		
R ³	(R ⁴) _n	R ⁵	R ⁶
SO ₂ CH ₃	(2-) CI	s	
SO₂CH₃	(2-) CI	s	
SO ₂ CH ₃	(2-) CI	s	
SO ₂ CH ₃	(2-) CI	s	
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	s	
SO ₂ CH ₃	(2-) CI	SCH=C=CH ₂	\triangle
SO₂CH₃	(2-) Cl	SCH ₂ CN	\triangle
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	SCH ₂ CH ₂ CN	\triangle
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	OCH ₃	\triangle
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	OC ₂ H ₅	\triangle
SO ₂ CH ₃	(2-) CI	OC ₃ H ₇	

	(Position-)		
R^3	(R ⁴) _n	R ⁵	R ⁶
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	OC ₃ H ₇ -i	
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	OC ₄ H ₉	
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	OCH ₂ CF ₃	
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	__\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\	
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	OC ₆ H ₅	
SO₂CH₃	(2-) Cl	Н	
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	CH ₃	
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	C ₂ H ₅	
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	C ₃ H ₇	
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	C ₃ H ₇ -i	
SO ₂ CH ₃	(2-) CI	C₄H ₉	
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	C₄H₀-i	\triangle
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	C ₄ H ₉ -s	

	(Position-)		
n3		_ 6	
R ³	(R ⁴) _n	R ⁵	R ⁶
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	C₄H9-t	\triangle
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	\triangle	\triangle
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	\searrow	\triangle
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	CH=CHCH;	\triangle
SO₂CH₃	(2-) Cl		\triangle
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	CI	\triangle
SO₂CH₃	(2-) CI		\triangle
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	N(CH ₃) ₂	\triangle
SO₂CH₃	(2-) CI	N	\triangle
SO ₂ CH ₃	(2-) C1	Cl	\triangle
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	Br	\triangle
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	CF ₃	\triangle

	(Position-)		
R ³	$(R^4)_n$	R ⁵	R ⁶
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	SCH,	\triangle
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	SC ₂ H ₅	\triangle
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	SC ₃ H ₇	\triangle
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	SC ₃ H ₇ -i	
CI	(2-) SO ₂ CH ₃	s	
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	s	
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	s	
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	s	
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	s	\triangle
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	SCH=C=CH ₂	\triangle
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	SCH ₂ CN	

	(Position-)		T
R³	(R ⁴) _n	R ⁵	R ⁶
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	SCH ₂ CH ₂ CN	
CI	(2-) SO ₂ CH ₃	OCH ₃	\triangle
CI	(2-) SO ₂ CH ₃	OC ₂ H ₅	
CI	(2-) SO ₂ CH ₃	OC ₃ H ₇	
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	OC ₃ H ₇ -i	
CI	(2-) SO ₂ CH ₃	OC₄H ₉	
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	OCH ₂ CF ₃	
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃		\triangle
CI	(2-) SO ₂ CH ₃	OC ₆ H ₅	\triangle
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	Н	\triangle
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	CH ₃	\triangle
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	C ₂ H ₅	\triangle
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	C ₃ H ₇	

	(Position-)		
\mathbb{R}^3	(R ⁴) _n	R ⁵	R ⁶
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	C ₃ H ₇ -i	\triangle
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	C₄H ₉	\triangle
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	C₄H9-i	\triangle
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	C ₄ H ₉ -s	\triangle
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	C ₄ H ₉ -t	\triangle
Ci	(2-) SO ₂ CH ₃	\triangle	\triangle
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	\triangle	\triangle
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	CH=CHCH,	\triangle
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃		
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃		
CI	(2-) SO ₂ CH ₃		
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂	\triangle

	(Position-)	I	1
7	}		
R ³	$(R^4)_n$	R ⁵	R ⁶
CI	(2-) SO ₂ CH ₃	N	\triangle
CI	(2-) SO ₂ CH ₃	CI	\triangle
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	Br	\triangle
CI	(2-) Cl	CF ₃	N(CH ₃) ₂
CI	(2-) CI	SCH ₃	N(CH ₃) ₂
CI	(2-) Cl	SC ₂ H ₅	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) Cl	SC ₃ H ₇	N(CH ₃) ₂
CI	(2-) Cl	SC ₃ H ₇ -i	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) Cl	s	N(CH ₃) ₂
CI	(2-) Cl	_s_	N(CH ₃) ₂
CI	(2-) Cl	s	N(CH ₃) ₂
CI	(2-) Cl	s	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) Cl	_s	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) CI	SCH=C=CH ₂	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) Cl	SCH ₂ CN	N(CH ₃) ₂

	(Position-)		
R³	$(R^4)_n$	R ⁵	R ⁶
Cl	(2-) CI	SCH ₂ CH ₂ CN	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) Cl	OCH ₃	N(CH ₃) ₂
C1	(2-) Cl	OC ₂ H ₅	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) Cl	OC₃H₁	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) Cl	OC₃H₁-i	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) CI	OC₄H ₉	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) CI	OCH ₂ CF ₃	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) CI	∇	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) Cl	OC ₆ H ₅	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) Cl	Н	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) CI	CH ₃	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) Cl	$C_2\overline{H}_5$	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) Cl	C ₃ H ₇	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) Cl	C ₃ H ₇ -i	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) Cl	C₄H ₉	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) Cl	C ₄ H ₉ -i	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) Cl	C ₄ H ₉ -s	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) CI	C ₄ H ₉ -t	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) Cl	\triangle	N(CH ₂) ₂
Cl	(2-) Cl	\triangle	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) Cl	CH=CHCH ₃	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) CI		N(CH ₃) ₂

	(Position-)		
R³	(R ⁴) _n	R ⁵	R ⁶
Cl	(2-) Cl		OI N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) CI		N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) Cl	N(CH ₃) ₂	N(CH ₃) ₂
CI	(2-) CI	N	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) Cl	Cl	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) Cl	Br	N(CH ₃) ₂
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	CF ₃	N(CH ₃) ₂
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	SCH ₃	N(CH ₃) ₂
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	SC ₂ H ₅	N(CH ₃) ₂
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	SC ₃ H ₇	N(CH ₃) ₂
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	SC ₃ H ₇ -i	N(CH ₃) ₂
SO₂CH₃	(2-) Cl	s	N(CH ₃) ₂
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	s	N(CH ₃) ₂
SO₂CH₃	(2-) Cl	s	N(CH ₃) ₂
SO ₂ CH ₃	(2-) CI	s	N(CH ₃) ₂

	(Position-)		
R³	$(R^4)_n$	R ⁵	R ⁶
SO ₂ CH ₃	(2-) CI		N(CH ₃) ₂
		J	
		s	
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	SCH=C=CH ₂	N(CH ₃) ₂
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	SCH₂CN	N(CH ₃) ₂
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	SCH ₂ CH ₂ CN	N(CH ₃) ₂
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	OCH ₃	N(CH ₃) ₂
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	OC ₂ H ₅	N(CH ₃) ₂
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	OC ₃ H ₇	N(CH ₃) ₂
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	OC ₃ H ₇ -i	N(CH ₃) ₂
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	OC₄H ₉	N(CH ₃) ₂
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	OCH ₂ CF ₃	N(CH ₃) ₂
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	∇	N(CH ₃) ₂
		0	
SO₂CH₃	(2-) Cl	OC ₆ H ₅	N(CH ₃) ₂
SO₂CH₃	(2-) Cl	Н	N(CH ₃) ₂
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	CH ₃	N(CH ₃) ₂
SO₂CH₃	(2-) Cl	C ₂ H ₅	N(CH ₃) ₂
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	C ₃ H ₇	N(CH ₃) ₂
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	C ₃ H ₇ -i	N(CH ₃) ₂
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	C ₄ H ₉	N(CH ₃) ₂
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	C ₄ H ₉ -i	N(CH ₃) ₂
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	C ₄ H ₉ -s	N(CH ₃) ₂
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	C ₄ H ₉ -t	N(CH ₃) ₂
SO ₂ CH ₃	(2-) CI		N(CH ₃) ₂

	(Position-)		
R ³	(R ⁴) _n	R ⁵	R ⁶
SO ₂ CH ₃	(2-) CI	\triangle	N(CH ₃) ₂
SO₂CH₃	(2-) CI	CH=CHCH ₃	N(CH ₃) ₂
SO ₂ CH ₃	(2-) CI		N(CH ₃) ₂
SO ₂ CH ₃	(2-) CI	CI	N(CH ₃) ₂
SO₂CH₃	(2-) CI		N(CH ₃) ₂
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	N(CH ₃) ₂	N(CH ₃) ₂
SO₂CH₃	(2-) CI	N	N(CH ₃) ₂
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	Cl	N(CH ₃) ₂
SO₂CH₃	(2-) CI	Br	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	CF ₃	$N(CH_3)_2$
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	SCH ₃	N(CH ₃) ₂
CI	(2-) SO ₂ CH ₃	SC ₂ H ₅	$N(CH_3)_2$
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	SC₃H₁	$N(CH_3)_2$
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	SC₃H₂-i	$N(CH_3)_2$
CI	(2-) SO ₂ CH ₃	s	N(CH ₃) ₂
CI	(2-) SO ₂ CH ₃	s	N(CH ₃) ₂

	(Position-)		
\mathbb{R}^3	(R ⁴) _n	R ⁵	R ⁶
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	s	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃		N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	s	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	SCH=C=CH ₂	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	SCH₂CN	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	SCH ₂ CH ₂ CN	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	OCH ₃	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	OC ₂ H ₅	N(CH ₃) ₂
CI	(2-) SO ₂ CH ₃	OC ₃ H ₇	N(CH ₃) ₂
CI	(2-) SO ₂ CH ₃	OC ₃ H ₇ -i	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	OC ₄ H ₉	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	OCH ₂ CF ₃	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃		N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	OC ₆ H ₅	$N(CH_3)_2$
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	Н	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	CH ₃	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	C ₂ H ₅	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	C ₃ H ₇	N(CH ₃) ₂
CI	(2-) SO ₂ CH ₃	C3H7-i	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	C ₄ H ₉	N(CH ₃) ₂
CI	(2-) SO ₂ CH ₃	C ₄ H ₉ -i	N(CH ₁) ₂

1	(Position-)		
R³	$(R^4)_n$	R ⁵	R ⁶
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	C ₄ H ₉ -s	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	C ₄ H ₉ -t	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	\triangle	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	\triangle	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	CH=CHCH ₃	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃		N(CH ₃) ₂
CI	(2-) SO ₂ CH ₃	CI	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃		N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂	N(CH ₃) ₂
CI	(2-) SO ₂ CH ₃	N	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	Cl	N(CH ₃) ₂
CI	(2-) SO ₂ CH ₃	Br	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) Cl	CH ₃	OCH ₃
Cl	(2-) Cl	C ₂ H ₅	OCH ₃
CI	(2-) Cl	C ₃ H ₇	OCH ₃
Cl	(2-) Cl	SCH ₃	OCH ₃
Cl	(2-) Cl	SC ₂ H ₅	OCH ₃
Cl	(2-) Cl	OCH ₃	OCH ₃
Cl	(2-) Cl	OC ₂ H ₅	OCH ₃
Cl	(2-) CI	CH ₃	OC ₂ H ₅

	(Position-)		
\mathbb{R}^3	$(R^4)_n$	R ⁵	R ⁶
Cl	(2-) Cl	C ₂ H ₅	OC ₂ H ₅
Cl	(2-) Cl	C ₃ H ₇	OC ₂ H ₅
Cl	(2-) Cl	SCH ₃	OC ₂ H ₅
Cl	(2-) Cl	SC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅
Cl	(2-) Cl	OCH ₃	OC ₂ H ₅
Cl	(2-) Cl	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	CH ₃	OCH ₃
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	C ₂ H ₅	OCH ₃
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	C ₃ H ₇	OCH ₃
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	SCH ₃	OCH ₃
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	SC ₂ H ₅	OCH ₃
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	OCH ₃	OCH ₃
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	OC ₂ H ₅	OCH ₃
CI	(2-) SO ₂ CH ₃	CH ₃	OC ₂ H ₅
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	C ₂ H ₅	OC ₂ H ₅
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	C ₃ H ₇	OC ₂ H ₅
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	SCH ₃	OC ₂ H ₅
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	SC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅
CI	(2-) SO ₂ CH ₃	OCH ₃	OC ₂ H ₅
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	Cl	OCH ₃
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	Br	OCH ₃
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	CH ₃	OCH ₃
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	C ₂ H ₅	OCH ₃
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	C ₃ H ₇	OCH ₃
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	SCH ₃	OCH ₃
SO ₂ CH ₃	(2-) CI	SC ₂ H ₅	OCH ₃
SO ₂ CH;	(2-) Cl	OCH ₃	OC ₂ H ₅

	(Position-)		T
\mathbb{R}^3	(R ⁴) _n	R ⁵	R ⁶
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	CH ₃	OC ₂ H ₅
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	C ₂ H ₅	OC ₂ H ₅
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	C ₃ H ₇	OC ₂ H ₅
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	SCH ₃	OC ₂ H ₅
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	SC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	OCH ₃	OC ₂ H ₅

Gruppe 5

5

 R^3 , $(R^4)_n$, R^5 und R^6 haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 4 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 6

$$H_3C$$
 $N-N$
 CH_3
 $N-R^6$
 R^3
 R^5
(IB-3)

R³, (R⁴)_n, R⁵ und R⁶ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 4 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 7

5

R³, (R⁴)_n, R⁵ und R⁶ haben hierbei beispielhaft die in der nachstehenden Tabelle angegebenen Bedeutungen:

	(Position-)		
R ³	(R ⁴) _n	R ⁵	R ⁶
Н	-	CF ₃	CH ₃
F	-	CF ₃	CH ₃
Cl	-	CF ₃	CH ₃
Br	-	CF ₃	CH ₃

10

Gruppe 8

- 49 - PCT/EP00/02292

R³, (R⁴)_n, R⁵ und R⁶ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 7 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 9

WO 00/58306

$$H_3C-N$$
 CH_3
 N
 N
 N
 R^6
 R^5
 R^5
 R^5

5

R³, (R⁴)_n, R⁵ und R⁶ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 7 angegebenen Bedeutungen.

10 Gruppe 10

R³, (R⁴)_n, R⁵ und R⁶ haben hierbei beispielhaft die in der nachstehenden Tabelle angegebenen Bedeutungen:

15

	(Position-)		
R^3	(Position-) (R ⁴) _n	R ⁵	R ⁶
Н	(2-) F	CF ₃	CH ₃
H	(2-) Cl	CF ₃	CH ₃
Н	(2-) Br	CF ₃	CH ₃
Н	-	CF ₃	CH ₃

Gruppe 11

$$H_5C_2$$
 H_5C_2
 H_5
 H

5 R³, (R⁴)_n, R⁵ und R⁶ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 10 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 12

10

R³, (R⁴)_n, R⁵ und R⁶ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 10 angegebenen Bedeutungen.

Die neuen substituierten Benzoylpyrazole der allgemeinen Formel (I) zeichnen sich durch starke und selektive herbizide Wirksamkeit aus.

Man erhält die neuen substituierten Benzoylpyrazole der allgemeinen Formel (I), wenn man

20 (a) Pyrazole der allgemeinen Formel (II)

in welcher

5

15

20

R¹, R² und Y die oben angegebene Bedeutung haben,

mit substituierten Benzoesäuren der allgemeinen Formel (III),

HO
$$(R^4)_n$$

$$A Z$$

$$(III)$$

in welcher

10

n, A, \mathbb{R}^3 , \mathbb{R}^4 und Z die oben angegebene Bedeutung haben,

in Gegenwart eines Dehydratisierungsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart eines oder mehrerer Reaktionshilfsmittel und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

oder wenn man

(b) Pyrazole der allgemeinen Formel (II)

in welcher

R¹, R² und Y die oben angegebene Bedeutung haben,

mit substituierten Benzoesäurederivaten der allgemeinen Formel (IV)

5

$$X \xrightarrow{O} (R^4)_n$$

$$A Z$$

$$R^3 \qquad (IV)$$

in welcher

n, A, R^3 , R^4 und Z die oben angegebene Bedeutung haben, und

10

- X für Cyano, Halogen oder Alkoxy steht,
- oder mit entsprechenden Carbonsäureanhydriden -
- gegebenenfalls in Gegenwart eines oder mehrerer Reaktionshilfsmittel und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

oder wenn man

20 (c) substituierte Benzoylpyrazole der allgemeinen Formel (Ia)

$$R^{2}$$
 $(R^{4})_{n}$
 R^{3}
 (Ia)

in welcher

n, A, R¹, R², R³, R⁴ und Z die oben angegebene Bedeutung haben,

mit Verbindungen der allgemeinen Formel (V)

5 H-Y (V)

in welcher

- Y mit Ausnahme von Wasserstoff die oben angegebene Bedeutung hat,
- oder gegebenenfalls mit entsprechenden Isocyanaten oder Isothiocyanaten -

gegebenenfalls in Gegenwart eines oder mehrerer Reaktionshilfsmittel und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

- und gegebenenfalls im Anschluss daran an den so erhaltenen Verbindungen der Formel (I) im Rahmen der Substituentendefinition auf übliche Weise elektrophile oder nucleophile bzw. Oxidations- oder Reduktionsreaktionen durchführt oder die Verbindungen der Formel (I) auf übliche Weise in Salze überführt.
- Die Verbindungen der Formel (I) können nach üblichen Methoden in andere Verbindungen der Formel (I) gemäß obiger Definition umgewandelt werden, beispielsweise durch nucleophile Substitution (z.B. R⁵: Cl → OC₂H₅, SCH₃) oder durch Oxidation (z.B. R⁵: CH₂SCH₃ → CH₂S(O)CH₃).
- Verwendet man beispielsweise 3-Chlor-5-hydroxy-1-methyl-pyrazol und 2-(3-Carboxy-5-fluor-benzyl)-5-ethyl-4-methoxy-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-on als Ausgangsstoffe, so kann der Reaktionsablauf beim erfindungsgemäßen Verfahren (a) durch das folgende Formelschema skizziert werden:

Verwendet man beispielsweise 3-Cyano-5-hydroxy-1-ethyl-pyrazol und 2-(3-Methoxycarbonyl-5-chlor-benzyl)-4-ethyl-5-methylthio-2,4-dihydro-3H-1,2,4-tri-azol-3-on als Ausgangsstoffe, so kann der Reaktionsablauf beim erfindungsgemäßen Verfahren (b) durch das folgende Formelschema skizziert werden:

5

15

20

Verwendet man beispielsweise 4-Methyl-5-trifluormethyl-2-[3-chlor-4-(1-ethyl-5-hydroxy-pyrazol-4-yl-carbonyl)-phenyl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-on und Benzoylchlorid als Ausgangsstoffe, so kann der Reaktionsablauf beim erfindungsgemäßen Verfahren (c) durch das folgende Formelschema skizziert werden:

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (a) zur Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I) als Ausgangsstoffe zu verwendenden Pyrazole sind durch die Formel (II) allgemein definiert. In der allgemeinen Formel (II) haben R¹. R² und Y vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) als

WO 00/58306 - 55 - PCT/EP00/02292

bevorzugt, besonders bevorzugt, ganz besonders bevorzugt oder am meisten bevorzugt für R¹, R² und Y angegeben worden sind.

Die Ausgangsstoffe der allgemeinen Formel (II) sind bekannt und/oder können nach an sich bekannten Verfahren hergestellt werden (vgl. EP-A-240001).

5

10

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (a) weiter als Ausgangsstoffe zu verwendenden substituierten Benzoesäuren sind durch die Formel (III) allgemein definiert. In der Formel (III) haben n, A, R³, R⁴ und Z vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt, ganz besonders bevorzugt oder am meisten bevorzugt für n, A, R³, R⁴ und Z angegeben wurden.

Die Ausgangsstoffe der allgemeinen Formel (III) sind mit Ausnahme von 2-(5-15 Carboxy-2,4-dichlor-phenyl)-4-difluormethyl-5-methyl-2,4-dihydro-3H-1,2,4triazol-3-on - alias 2,4-Dichlor-5-(4-difluormethyl-4,5-dihydro-3-methyl-5-oxo-1H-1,2,4-triazol-1-yl)-benzoesäure (CAS-Reg.-Nr. 90208-77-8) und 2-(5-Carboxy-2,4dichlor-phenyl)-4,5-dimethyl-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-on - alias 2,4-Dichlor-20 5-(4,5-dihydro-3,4-dimethyl-5-oxo-1H-1,2,4-triazol-1-yl)-benzoesäure (CAS-Reg.-Nr. 90208-76-7) - noch nicht aus der Literatur bekannt. Sie sind jedoch unter Ausnahme von 2-(5-Carboxy-2,4-dichlor-phenyl)-4-difluormethyl-5-methyl-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-on und 2-(5-Carboxy-2,4-dichlor-phenyl)-4,5-dimethyl-2,4dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-on (vgl. JP-A-58225070 - zitiert in Chem. Abstracts 25 100:209881, JP-A-02015069 - zitiert in Chem. Abstracts 113:23929) Gegenstand einer vorgängigen, jedoch nicht vorveröffentlichten Anmeldung (vgl. DE-A-19833360).

Man erhält die substituierten Benzoesäuren der allgemeinen Formel (III), wenn man Benzoesäurederivate der allgemeinen Formel (VI),

WO 00/58306 - 56 -

$$X^1$$

$$A Z$$

$$R^3$$
(VI)

in welcher

n, A, R³ und R⁴ und Z die oben angegebene Bedeutung haben, und

5

10

15

20

X¹ für Cyano, Carbamoyl, Halogencarbonyl oder Alkoxycarbonyl steht,

mit Wasser, gegebenenfalls in Gegenwart eines Hydrolysehilfsmittels, wie z.B. Schwefelsäure, bei Temperaturen zwischen 50°C und 120°C umsetzt (vgl. die Herstellungsbeispiele).

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (b) zur Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I) als Ausgangsstoffe zu verwendenden substituierten Benzoesäurederivate sind durch die Formel (IV) allgemein definiert. In der allgemeinen Formel (IV) haben n, A, R³, R⁴ und Z vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt, ganz besonders bevorzugt oder am meisten bevorzugt für n, A, R³, R⁴ und Z angegeben worden sind; X steht vorzugsweise für Cyano, Fluor, Chlor, Brom oder C₁-C₄-Alkoxy, insbesondere für Chlor, Methoxy oder Ethoxy.

Die Ausgangsstoffe der allgemeinen Formel (IV) – sowie die Vorprodukte der allgemeinen Formel (VI) - sind bekannt und/oder können nach an sich bekannten Verfahren hergestellt werden (vgl. DE-A-3839480, DE-A-4239296, EP-A-597360, EP-A-609734, DE-A-4303676, EP-A-617026, DE-A-4405614, US-A-5378681).

25

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (c) zur Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel (l) als Ausgangsstoffe zu verwendenden substituierten Benzoylpyrazole sind durch die Formel (la) allgemein definiert. In der allgemeinen Formel

WO 00/58306 - 57 - PCT/EP00/02292

(Ia) haben n, A, R¹, R², R³, R⁴ und Z vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt, ganz besonders bevorzugt oder am meisten bevorzugt für n, A, R¹, R², R³, R⁴ und Z angegeben worden sind.

Die Ausgangsstoffe der allgemeinen Formel (Ia) sind erfindungsgemäße, neue Verbindungen; sie können nach den erfindungsgemäßen Verfahren (a) und (b) hergestellt werden.

10

15

5

Die beim erfindungsgemäßen (c) weiter als Ausgangsstoffe zu verwendenden Verbindungen sind durch die Formel (V) allgemein definiert. In der allgemeinen Formel (V) hat Y vorzugsweise diejenige Bedeutung, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt, ganz besonders bevorzugt oder am meisten bevorzugt für Y angegeben worden ist.

Die Ausgangsstoffe der allgemeinen Formel (V) sind bekannte Synthesechemikalien.

- Das erfindungsgemäße Verfahren (a) zur Herstellung der neuen substituierten Benzoylpyrazole der allgemeinen Formel (I) wird unter Verwendung eines Dehydratisierungsmittels durchgeführt. Es kommen hierbei die üblichen zur Bindung von Wasser geeigneten Chemikalien in Betracht.
- Als Beispiele hierfür seien Dicyclohexylcarbodiimid und Carbonyl-bis-imidazol genannt.

Als besonders gut geeignetes Dehydratisierungsmittel sei Dicyclohexylcarbodiimid genannt.

Das erfindungsgemäße Verfahren (a) zur Herstellung der neuen substituierten Benzoylpyrazole der allgemeinen Formel (I) wird gegebenenfalls unter Verwendung eines Reaktionshilfsmittels durchgeführt.

Als Beispiele hierfür seien Natriumcyanid, Kaliumcyanid, Acetoncyanhydrin, 2-Cyano-2-(trimethylsilyloxy)-propan und Trimethylsilylcyanid genannt.

Als besonders gut geeignetes Reaktionshilfsmittel sei Trimethylsilylcyanid genannt.

Das erfindungsgemäße Verfahren (b) zur Herstellung der neuen substituierten Benzoylpyrazole der allgemeinen Formel (l) wird gegebenenfalls unter Verwendung von Reaktionshilfsmitteln durchgeführt.

15

20

25

Als Beispiele hierfür seien (konz.) Schwefelsäure, Zinkchlorid, Aluminiumchlorid, und Borfluorid genannt.

Die erfindungsgemäßen Verfahren zur Herstellung der neuen substituierten Benzoylpyrazole der allgemeinen Formel (I) werden gegebenenfalls unter Verwendung weiterer Reaktionshilfsmittel durchgeführt. Als (weitere) Reaktionshilfsmittel für die erfindungsgemäßen Verfahren kommen im allgemeinen basische organische Stickstoffverbindungen, wie beispielsweise Trimethylamin, Triethylamin, Tripropylamin, Tributylamin, Ethyl-diisopropylamin, N,N-Dimethyl-cyclohexylamin, Dicyclohexylamin, Ethyl-dicyclohexylamin, N,N-Dimethyl-anilin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, 2-Methyl-, 3-Methyl-, 4-Methyl-, 2,4-Dimethyl-, 2,6-Dimethyl-, 3,4-Dimethyl- und 3,5-Dimethyl-pyridin, 5-Ethyl-2-methyl-pyridin, 4-Dimethylaminopyridin, N-Methyl-piperidin, 1,4-Diazabicyclo[2,2,2]-octan (DABCO). 1,5-Diazabicyclo[4,3,0]-non-5-en (DBN), oder 1,8-Diazabicyclo[5,4,0]-undec-7-en (DBU) in Betracht.

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (a). (b) und (c) kommen vor allem inerte organische Lösungsmittel in Betracht. Hierzu

WO 00/58306 - 59 - PCT/EP00/02292

gehören insbesondere aliphatische, alicyclische oder aromatische, gegebenenfalls halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Benzin, Benzol, Toluol, Xylol, Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Petrolether, Hexan, Cyclohexan, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan oder 1,2-Dichlor-ethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, Ethylenglykoldimethyl- oder -diethylether; Ketone, wie Aceton, Butanon oder Methyl-isobutyl-keton; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril oder Butyronitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methyl-formanilid, N-Methyl-pyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester, Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid.

5

10

15

20

25

30

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (a), (b) und (c) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 150°C, vorzugsweise zwischen 10°C und 120°C.

Die erfindungsgemäßen Verfahren (a), (b) und (c) werden im allgemeinen unter Normaldruck durchgeführt. Es ist jedoch auch möglich, die erfindungsgemäßen Verfahren unter erhöhtem oder vermindertem Druck - im allgemeinen zwischen 0,1 bar und 10 bar - durchzuführen.

Zur Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (a), (b) und (c) werden die Ausgangsstoffe im allgemeinen in angenähert äquimolaren Mengen eingesetzt. Es ist jedoch auch möglich, eine der Komponenten in einem größeren Überschuss zu verwenden. Die Umsetzung wird im allgemeinen in einem geeigneten Verdünnungsmittel in Gegenwart eines Dehydratisierungsmittels durchgeführt und das Reaktionsgemisch wird im allgemeinen mehrere Stunden bei der erforderlichen Temperatur gerührt. Die Aufarbeitung wird nach üblichen Methoden durchgeführt (vgl. die Herstellungsbeispiele).

WO 00/58306 - 60 -

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als Defoliants, Desiccants, Krautabtötungsmittel und insbesondere als Unkrautvernichtungsmittel verwendet werden. Unter Unkraut im weitesten Sinne sind alle Pflanzen zu verstehen, die an Orten aufwachsen, wo sie unerwünscht sind. Ob die erfindungsgemäßen Stoffe als totale oder selektive Herbizide wirken, hängt im wesentlichen von der angewendeten Menge ab.

Erfindungsgemäß können alle Pflanzen und Pflanzenteile behandelt werden. Unter Pflanzen werden hierbei alle Pflanzen und Pflanzenpopulationen verstanden, wie erwünschte und unerwünschte Wildpflanzen oder Kulturpflanzen (einschließlich natürlich vorkommender Kulturpflanzen). Kulturpflanzen können Pflanzen sein, die durch konventionelle Züchtungs- und Optimierungsmethoden oder durch biotechnologische und gentechnologische Methoden oder Kombinationen dieser Methoden erhalten werden können, einschließlich der transgenen Pflanzen und einschließlich der durch Sortenschutzrechte schützbaren oder nicht schützbaren Pflanzensorten. Unter Pflanzenteilen sollen alle oberirdischen und unterirdischen Teile und Organe der Pflanzen, wie Spross, Blatt, Blüte und Wurzel verstanden werden, wobei beispielhaft Blätter, Nadeln, Stengel, Stämme, Blüten, Fruchtkörper, Früchte und Samen sowie Wurzeln, Knollen und Rhizome aufgeführt werden. Zu den Pflanzenteilen gehört auch Erntegut sowie vegetatives und generatives Vermehrungsmaterial, beispielsweise Stecklinge, Knollen, Rhizome, Ableger und Samen.

Die erfindungsgemäße Behandlung der Pflanzen und Pflanzenteile mit den Wirkstoffen erfolgt direkt oder durch Einwirkung auf deren Umgebung, Lebensraum oder Lagerraum nach den üblichen Behandlungsmethoden, z.B. durch Tauchen, Sprühen, Verdampfen, Vernebeln, Streuen, Aufstreichen und bei Vermehrungsmaterial, insbesondere bei Samen, weiterhin durch ein- oder mehrschichtiges Umhüllen.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können z.B. bei den folgenden Pflanzen verwendet werden:

5

10

15

20

25

<u>Dikotyle Unkräuter der Gattungen:</u> Sinapis, Lepidium, Galium, Stellaria, Matricaria, Anthemis, Galinsoga, Chenopodium, Urtica, Senecio, Amaranthus, Portulaca, Xanthium, Convolvulus, Ipomoea, Polygonum, Sesbania, Ambrosia, Cirsium, Carduus, Sonchus, Solanum, Rorippa, Rotala, Lindernia, Lamium, Veronica, Abutilon, Emex, Datura, Viola, Galeopsis, Papaver, Centaurea, Trifolium, Ranunculus, Taraxacum.

5

10

15

20

25

30

<u>Dikotyle Kulturen der Gattungen:</u> Gossypium, Glycine, Beta, Daucus, Phaseolus, Pisum, Solanum, Linum, Ipomoea, Vicia, Nicotiana, Lycopersicon. Arachis, Brassica, Lactuca, Cucumis, Cucurbita.

Monokotyle Unkräuter der Gattungen: Echinochloa, Setaria, Panicum, Digitaria, Phleum, Poa, Festuca, Eleusine, Brachiaria, Lolium, Bromus, Avena, Cyperus, Sorghum, Agropyron, Cynodon, Monochoria, Fimbristylis, Sagittaria, Eleocharis, Scirpus, Paspalum, Ischaemum, Sphenoclea, Dactyloctenium, Agrostis, Alopecurus, Apera, Aegilops, Phalaris.

Monokotyle Kulturen der Gattungen: Oryza, Zea, Triticum, Hordeum, Avena, Secale, Sorghum, Panicum, Saccharum, Ananas, Asparagus, Allium.

Die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe ist jedoch keineswegs auf diese Gattungen beschränkt, sondern erstreckt sich in gleicher Weise auch auf andere Pflanzen.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich in Abhängigkeit von der Konzentration zur Totalunkrautbekämpfung, z.B. auf Industrie- und Gleisanlagen und auf Wegen und Plätzen mit und ohne Baumbewuchs. Ebenso können die erfindungsgemäßen Wirkstoffe zur Unkrautbekämpfung in Dauerkulturen, z.B. Forst, Ziergehölz-, Obst-, Wein-, Citrus-, Nuss-, Bananen-, Kaffee-, Tee-, Gummi-, Ölpalm-, Kakao-, Beerenfrucht- und Hopfenanlagen, auf Zier- und Sportrasen und Weide-

flächen sowie zur selektiven Unkrautbekämpfung in einjährigen Kulturen eingesetzt werden.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) zeigen starke herbizide Wirksamkeit und ein breites Wirkungsspektrum bei Anwendung auf dem Boden und auf oberirdische Pflanzenteile. Sie eignen sich in gewissem Umfang auch zur selektiven Bekämpfung von monokotylen und dikotylen Unkräutern in monokotylen und dikotylen Kulturen, sowohl im Vorauflauf- als auch im Nachauflauf-Verfahren.

Die Wirkstoffe können in die üblichen Formulierungen übergeführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Spritzpulver, Suspensionen, Pulver, Stäubemittel, Pasten, lösliche Pulver, Granulate, Suspensions-Emulsions-Konzentrate, Wirkstoff-imprägnierte Natur- und synthetische Stoffe sowie Feinstverkapselungen in polymeren Stoffen.

15

20

25

30

5

Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z. B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln und/oder Dispergiermitteln und/oder schaumerzeugenden Mitteln.

Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel können z.B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im wesentlichen in Frage: Aromaten, wie Xylol, Toluol, oder Aikylnaphthaline, chlorierte Aromaten und chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzole, Chlorethylene oder Methylenchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine. z.B. Erdölfraktionen, mineralische und pflanzliche Öle, Alkohole, wie Butanol oder Glykol sowie deren Ether und Ester. Ketone wie Aceton. Methylethylketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon. stark polare Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser.

WO 00/58306 PCT/EP00/02292

Als feste Trägerstoffe kommen in Frage: z.B. Ammoniumsalze und natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate, als feste Trägerstoffe für Granulate kommen in Frage: z.B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Marmor, Bims, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnussschalen, Maiskolben und Tabakstengeln; als Emulgier- und/oder schaumerzeugende Mittel kommen in Frage: z.B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäure-Ester, Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, z.B. Alkylarylpolyglykolether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Eiweißhydrolysate; als Dispergiermittel kommen in Frage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische pulvrige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospholipide, wie Kephaline und Lecithine und synthetische Phospholipide. Weitere Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.

20

5

10

Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z.B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyanin-farbstoffe und Spurennährstoffe wie Salze von Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink verwendet werden.

25

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gewichtsprozent Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 %.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als solche oder in ihren Formulierungen auch in Mischung mit bekannten Herbiziden zur Unkrautbekämpfung Verwendung finden, wobei Fertigformulierungen oder Tankmischungen möglich sind.

Für die Mischungen kommen bekannte Herbizide infrage, beispielsweise

Acetochlor, Acifluorfen(-sodium), Aclonifen, Alachlor, Alloxydim(-sodium), Ametryne, Amidochlor, Amidosulfuron, Anilofos, Asulam, Atrazine, Azafenidin, 5 Azimsulfuron, Benazolin(-ethyl), Benfuresate, Bensulfuron(-methyl), Bentazon, Benzofenap, Benzoylprop(-ethyl), Bialaphos, Bifenox, Bispyribac(-sodium), Bromobutide, Bromofenoxim, Bromoxynil, Butachlor, Butroxydim, Butylate, Cafenstrole, Caloxydim, Carbetamide, Carfentrazone(-ethyl), Chlomethoxyfen, Chloramben, Chloridazon, Chlorimuron(-ethyl), Chlornitrofen, Chlorsulfuron, Chlortoluron, Cini-10 Clodinafop(-propargyl), Cinmethylin, Cinosulfuron, Clethodim, don(-ethyl), Clomazone, Clomeprop, Clopyralid, Clopyrasulfuron(-methyl), Cloransulam(methyl), Cumyluron, Cyanazine, Cybutryne, Cycloate, Cyclosulfamuron, Cycloxydim, Cyhalofop(-butyl), 2,4-D, 2,4-DB, 2,4-DP, Desmedipham, Diallate, Dicamba, Diclofop(-methyl), Diclosulam, Diethatyl(-ethyl), Difenzoquat, Diflufenican, Diflu-15 fenzopyr, Dimefuron, Dimepiperate, Dimethachlor, Dimethametryn, Dimethenamid, Dimexyflam, Dinitramine, Diphenamid, Diquat, Dithiopyr, Diuron, Dymron, Epoprodan, EPTC, Esprocarb, Ethalfluralin, Ethametsulfuron(-methyl), Ethofumesate, Ethoxyfen, Ethoxysulfuron, Etobenzanid, Fenoxaprop(-P-ethyl), Flamprop(-isopropyl), Flamprop(-isopropyl-L), Flamprop(-methyl), Flazasulfuron, Fluazifop(-P-20 butyl), Fluazolate, Flucarbazone, Flufenacet, Flumetsulam, Flumiclorac(-pentyl), Flumioxazin, Flumipropyn, Flumetsulam, Fluometuron, Fluorochloridone, Fluoro-Flupoxam, Flupropacil, Flurpyrsulfuron(-methyl, -sodium), glycofen(-ethyl), Flurenol(-butyl), Fluridone, Fluroxypyr(-meptyl), Flurprimidol, Flurtamone, Fluthiacet(-methyl), Fluthiamide, Fomesafen, Glufosinate(-ammonium), Glyphosate(-25 isopropylammonium), Halosafen, Haloxyfop(-ethoxyethyl), Haloxyfop(-P-methyl), Hexazinone, Imazamethabenz(-methyl), lmazamethapyr, lmazamox, lmazapic, Imazapyr, Imazaquin, Imazethapyr, Imazosulfuron, Iodosulfuron, Ioxynil, Isopropalin, Isoproturon, Isouron, Isoxaben, Isoxachlortole, Isoxaflutole, Isoxapyrifop, Lactofen, Lenacil, Linuron, MCPA, MCPP, Mefenacet, Mesotrione, Metamitron, 30 Metazachlor, Methabenzthiazuron, Metobenzuron, Metobromuron, (alpha-)Metolachlor, Metosulam, Metoxuron, Metribuzin, Metsulfuron(-methyl), Molinate, Monolinuron, Naproanilide, Napropamide, Neburon, Nicosulfuron, Norflurazon, Orbencarb, Oryzalin, Oxadiargyl, Oxadiazon, Oxasulfuron, Oxaziclomefone, Oxyfluorfen, Paraquat, Pelargonsäure, Pendimethalin, Pentoxazone, Phenmedipham, Picolinafen, Piperophos, Pretilachlor, Primisulfuron(-methyl), Prometryn, Propachlor, Propanil, Propaquizafop, Propisochlor, Propyzamide, Prosulfocarb, Prosulfuron, Pyraflufen(ethyl), Pyrazolate, Pyrazosulfuron(-ethyl), Pyrazoxyfen, Pyribenzoxim, Pyributicarb, Pyridate, Pyriminobac(-methyl), Pyrithiobac(-sodium), Quinchlorac, Quinmerac, Quinoclamine, Quizalofop(-P-ethyl), Quizalofop(-P-tefuryl), Rimsulfuron, Sethoxydim, Simazine, Simetryn, Sulcotrione, Sulfentrazone, Sulfometuron(-methyl), Sulfosate, Sulfosulfuron, Tebutam, Tebuthiuron, Tepraloxydim, Terbuthylazine, Terbutryn, Thenylchlor, Thiafluamide, Thiazopyr, Thidiazimin, Thifensulfuron(-methyl), Triclopyr, Tridiphane, Trifluralin, Triflusulfuron und Tritosulfuron.

15

10

5

Auch eine Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen, wie Fungiziden, Insektiziden, Akariziden, Nematiziden, Schutzstoffen gegen Vogelfraß, Pflanzennährstoffen und Bodenstruktur-verbesserungsmitteln ist möglich.

20

Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus durch weiteres Verdünnen bereiteten Anwendungsformen, wie gebrauchsfertige Lösungen, Suspensionen, Emulsionen, Pulver, Pasten und Granulate angewandt werden. Die Anwendung geschieht in üblicher Weise, z.B. durch Gießen, Spritzen, Sprühen, Streuen.

25

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können sowohl vor als auch nach dem Auflaufen der Pflanzen appliziert werden. Sie können auch vor der Saat in den Boden eingearbeitet werden.

30

Die angewandte Wirkstoffmenge kann in einem größeren Bereich schwanken. Sie hängt im wesentlichen von der Art des gewünschten Effektes ab. Im allgemeinen

liegen die Aufwandmengen zwischen 1 g und 10 kg Wirkstoff pro Hektar Bodenfläche, vorzugsweise zwischen 5 g und 5 kg pro ha.

Die Herstellung und die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe geht aus den nachfolgenden Beispielen hervor.

Herstellungsbeispiele:

Beispiel 1

5

10

15

Eine Mischung aus 1,64 g (5 mMol) 4-Methyl-5-trifluormethyl-2-(3-chlor-4-carboxy-phenyl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-on, 0,62 g (5,5 mMol) 1-Ethyl-5-hydroxy-pyrazol und 40 ml Acetonitril wird bei Raumtemperatur (ca. 20°C) unter Rühren mit 1,13 g (5,5 mMol) Dicyclohexylcarbodiimid versetzt und die Reaktionsmischung wird 16 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Dann werden 1,0 g (10 mMol) Triethylamin und 0,2 g (2 mMol) Trimethylsilylcyanid dazu gegeben und die Mischung wird drei Tage bei Raumtemperatur gerührt. Anschließend werden 60 ml einer 2%igen wässrigen Natriumcarbonat-Lösung dazu gegeben und die Mischung wird drei Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Der ausgefallene Dicyclohexylharnstoff wird durch Absaugen abgetrennt und die Mutterlauge zweimal mit Diethylether geschüttelt. Die wässrige Phase wird unter Rühren durch Zugabe von konz. Salzsäure auf einen pH-Wert von ca. 1 eingestellt. Das sich hierbei abscheidende ölige Produkt wird mit Methylenchlorid extrahiert, die Extraktionslösung mit Magnesiumsulfat getrocknet und filtriert. Vom Filtrat wird das Lösungsmittel im Wasserstrahlvakuum sorgfältig abdestilliert.

20 Wasser

Man erhält 1,5 g (72% der Theorie) 4-Methyl-5-trifluormethyl-2-[3-chlor-4-(1-ethyl-5-hydroxy-pyrazol-4-yl-carbonyl)-phenyl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-on als amorphes Produkt.

25

logP (bei pH≈2 bestimmt): 2,63.

5

Analog zu Beispiel 1 sowie entsprechend der allgemeinen Beschreibung des erfindungsgemäßen Herstellungsverfahrens können beispielsweise auch die in der nachstehenden Tabelle 1 aufgeführten Verbindungen der allgemeinen Formel (I) - bzw. der Formeln (IA), (IB) oder (IC) - hergestellt werden.

- 68 -

Y
$$R^2$$
 R^2 R^3 R^5 (IB)

$$R^{1}$$
 N
 R^{2}
 R^{4}
 N
 N
 N
 R^{5}
 R^{5}
 R^{5}
 R^{5}
 R^{5}

<u>Tabelle 1</u>: Beispiele für die Verbindungen der Formel (I), (IA), (IB), (IC)
Y steht hierbei jeweils für Wasserstoff

	T	Т-	T^{-}			(Posi-			
Bsp	A	Q	RI	$ _{\mathbb{R}^2}$	R ³	1	5		(Formel)
Nr.	''	1	"		I K	tion)	R ⁵	R ⁶	Physikal.
2	CIL		10	<u> </u>		$(R^4)_n$			Daten
4	CH ₂	0	C ₂ H ₅	Н	CF ₃	-	OC₂H₅	CH ₃	(IA)
<u></u>				<u> </u>					$\log P = 2,34^a$
3	CH ₂	0	C ₂ H ₅	Н	CF ₃	-	SCH ₃	CH ₃	(IA)
						ł			$logP = 2.22^{a}$
4	CH ₂	0	C ₂ H ₅	H	SO ₂ CH ₃	-	SCH ₃	СН,	(IA)
					ł				$\log P = 1,24^{\text{ a}}$
5	CH ₂	0	C ₂ H ₅	Н	CF ₃	-	SC ₂ H ₅	CH ₃	(IA)
	ļ								$\log P = 2.58^{a}$
6	CH ₂	0	C ₂ H ₅	Н	CF,	-	SC ₃ H ₇ -i	CH ₃	(IA)
L									$logP = 2,90^{a}$
7	CH ₂	0	C ₂ H ₅	Н	CF ₃	-	OCH ₃		(IA)
						-			$logP = 2,28^{a}$
8	CH ₂	0	C ₂ H ₅	Н	F		N(CH ₃) ₂	CH ₃	(IA)
Ì							372	J,	$\log P = 1.61^{a}$
9	CH ₂	0	CH,	CH ₃	F	-	N(CH ₃) ₂	CH ₃	(IA)
							372	,	$\log P = 1.32^{*}$
10	CH ₂	0	CH ₃	CH ₃	F	-	OCH ₃	+	(IA)
							,,		$\log P = 1,50^{a}$
1 I	CH ₂	0	CH ₃	СН,	F				
•••	C11 ₂		CH ₃	СП,	r	-	OC ₂ H ₅		(IA)
					<u> </u>				$\log P = 1.80^{a}$
12	CH ₂	0	C ₂ H ₅	Н	Br	_		CH ₃	(IA)
							s		$logP = 2.69^{a}$
13	-	0	C ₂ H ₅	Н	H	(6-) CF ₃	CF ₃	CH ₃	(10)
į			• .			(0) 01 3	3	C113	(IB)
									$logP = 2.83^{a}$
14	-	0	C ₂ H ₅	Н	Н	(2-) Cl	СН	CH,	(IC)
						(=) 0.],		
							<u> </u>		$\log P = 1.71^{a}$

· · · · ·	<u> </u>	7			T	(Posi-		T	(Formel)
Bsp	Α	Q	Rl	\mathbb{R}^2	R ³	tion)	R ⁵	R ⁶	Physikal.
Nr.						(R ⁴) _n	!		Daten
15	-	0	C₂H,	Н	Н	-	CF ₃	СН,	(IA)
į									$\log P = 1,95^{a}$
16	-	0	C ₂ H ₅	Н	Cl	-	CF,	CH ₃	(IA)
									$logP = 2,47^{2}$
17	CH ₂	0	C ₂ H ₅	Н	CI	(2-) Cl	CF,	CH ₃	(IB)
								İ	$logP = 2,30^{a}$
18	CH ₂	0	C ₂ H ₅	Н	Cl	(2-) Cl	SCH ₃	CH ₃	(IB)
				<u> </u>	}				$\log P = 1.91^{a}$
19	CH ₂	0	C ₂ H ₅	Н	Cl	(2-) Cl	OC ₂ H ₅	CH ₃	(IB)
									$\log P = 2.01^{a}$
20	CH ₂	0	C ₂ H ₅	Н	Cl	(2-) CI			(IB)
									$\log P = 2,14^{a}$
21	CH ₂	0	C ₂ H ₅	Н	Cl	(2-) CI	OCH ₃	СН,	(IB)
									$logP = 1,69^{a}$
22	CH ₂	0	C ₂ H ₅	Н	CI	(2-) CI	OC ₃ H ₇ -i	СН,	(IB)
									$logP = 2,31^{a}$
23	CH ₂	0	C ₂ H ₅	Н	Cl	(2-) Cl	OCH ₂ CF ₃	CH ₃	(IB)
		ļ							$logP = 2,33^{a}$
24	CH ₂	0	C ₂ H ₅	Н	CI	(2-) Cl	Br	CH ₃	(IB)
									$\log P = 1.81^{a}$
25	CH ₂	0	C ₂ H ₅	Н	Cl	(2-) Cl	Н	CH ₃	(IB)
							<u> </u>		$\log P = 1.28^{a}$
26	CH ₂	0	C ₂ H ₅	Н	CI	(2-) Cl		CH ₃	(IB)
									$\log P = 1.82^{a}$
27	-	О	C ₂ H ₅	Н	Br	-	CF ₃	СН,	(IA)
									$logP = 2,55^{a}$
28	CH ₂	0	C ₂ H ₅	Н	Cl	(2-) CI	N(CH ₃) ₂	CH ₃	(IB)
									$logP = 1,77^{a}$
29	CH ₂	0	C ₂ H ₅	Н	Cl	(2-) CI	CH ₃	CH ₃	(IB)
									$\log P = 1,38^{a}$
30	CH ₂	0	C ₂ H ₅	Н	CI	(2-) Cl	R ⁵ + R ⁶ :	(vgl. R5)	(IB)
							(CH ₂) ₄		$logP = 1,55^{a}$

					T	(Posi-			(Formel)
Bsp	Α	Q	R ¹	R ²	R ³	tion)	R ⁵	R ⁶	Physikal.
Nr.						$(R^4)_n$			Daten
31	CH ₂	0	C ₂ H ₅	Н	Cl	(2-) CI	осн,		(IB)
									$logP = 1,99^{a}$
32	CH ₂	0	C ₂ H ₅	Н	Cl	(2-) Cl	OC ₂ H ₅		(IB)
									$logP = 2,31^{a}$
33	CH ₂	0	C ₂ H ₅	Н	Cl	(2-) Cl	OC₃H₁-i		(IB)
									$logP = 4,64^{a}$
34	CH ₂	0	C ₂ H ₅	Н	Cl	(2-) Cl	OCH ₂ CF ₃		(IB)
									$logP = 2,65^{a}$
35	CH ₂	0	C ₂ H ₅	Н	CI	(2-) Cl	SCH ₃		(IB)
									$logP = 2,27^{a}$
36	CH ₂	О	C ₂ H ₅	Н	Cl	(2-) Cl	CH ₃		(IB)
									$logP = 1,64^{a}$
37	CH ₂	0	C ₂ H ₅	Н	CI	(2-) Cl	N(CH ₃) ₂		(IB)
									$\log P = 2.04^{2}$
38	CH ₂	0	C ₂ H ₅	Н	CI	(2-) CI	C₂H₅	OC₂H,	(IB)
									$logP = 2,16^{a}$
39	CH ₂	0	CH ₃	CH ₃	Ci	(2-) Cl	Br	СН,	(IB)
		$oldsymbol{ol}}}}}}}}}}}}}}}}}}$			<u> </u>				$\log P = 1,52^{a}$
40	CH ₂	0	CH ₃	Н	CI	(2-) Cl	Br	CH ₃	(IB)
				ļ <u> </u>					$\log P = 1,53^{a}$
41	CH ₂	0	C ₂ H ₅	CH ₃	CI	(2-) CI	SCH ₃	СН,	(IB)
				ļ <u>.</u>					$logP = 1,91^{a}$
42	CH ₂	0	C ₂ H ₅	CH ₃	CI	(2-) CI	OC ₂ H ₅	CH ₃	(IB)
									$\log P = 2.02^{a}$
43	CH ₂	0	C ₂ H ₅	CH ₃	CI	(2-) Cl	осн,	CH ₃	(IB)
									$logP = 1,71^{-a}$
44	CH ₂	0	C ₂ H ₅	CH ₃	CI	(2-) Cl	Br	CH ₃	(IB)
									$logP = 1.81^{-a}$
45	CH ₂	0	C ₂ H ₅	CH ₃	CI	(2-) CI	CH ₃	CH ₃	(IB)
									$logP = 1,40^{-a}$

		T			<u> </u>	(Posi-			(Formel)
Bsp	Α	Q	R ¹	R ²	R ³	tion)	R ⁵	R ⁶	Physikal.
Nr.						$(R^4)_n$			Daten
46	CH ₂	0	t-	CH ₃	CI	(2-) Cl	SCH,	СН,	(IB)
			C ₄ H ₉			<u> </u>			$logP = 3,30^{a}$
47	CH ₂	0	t-	СН,	Cl	(2-) Cl	OC ₂ H ₅	CH ₃	(IB)
			C ₄ H ₉						$logP = 3,44^{a}$
48	CH ₂	0	t-	CH ₃	CI	(2-) CI	OCH ₃	CH ₃	(IB)
			C₄H ₉					İ	$logP = 3,02^{a}$
49	CH ₂	0	t-	СН,	Cl	(2-) Cl	Br	СН,	(IB)
			C ₄ H ₉						$\log P = 3,19^{a}$
50	CH ₂	0	t-	СН,	CI	(2-) Cl	CH ₃	CH ₃	(IB)
			C₄H ₉						$logP = 2,53^{a}$
51	CH ₂	0	СН,	сн,	Cl	(2-) Cl	SCH ₃	CH ₃	(IB)
							1		logP = 1,66 a
52	CH ₂	0	CH ₃	СН,	CI	(2-) CI	OC ₂ H ₅	CH ₃	(IB)
				j L	 				$logP = 1,76^{a}$
53	CH ₂	0	CH ₃	СН,	CI	(2-) Cl	OCH ₃	CH ₃	(IB)
									$logP = 1,48^{a}$
54	CH ₂	0	CH ₃	CH ₃	Cl	(2-) Cl	CH ₃	CH ₃	(IB)
				<u> </u>					$logP = 1,20^{a}$
55	CH ₂	0	CH ₃	Н	Cl	(2-) Cl	SCH,	CH ₃	(IB)
									$logP = 1,67^{a}$
56	CH ₂	0	CH ₃	Н	Cl	(2-) Cl	OC ₂ H ₅	CH ₃	(IB)
				<u>. </u>					$\log P = 1,77^{a}$
57	CH ₂	0	CH ₃	Н	CI	(2-) CI	осн,	CH₃	(IB)
									$logP = 1,48^{a}$
58	CH ₂	0	CH ₃	Н	CI	(2-) Cl	СН,	СН₃	(IB)
									$\log P = 1,19^{a}$
59	CH ₂	0	C ₂ H ₅	Н	ОСН,	(2-)	OC ₂ H ₅	CH ₃	(IC)
						NO ₂			$\log P = 1.99^{\text{ a}}$
60	CH ₂	0	C ₂ H ₅	Н	OCH ₃	(2-)	SCH ₃	CH ₃	(IC)
						NO ₂			$logP = 1,92^{-a}$
61	CH ₂	0	C ₂ H ₅	Н	CF ₃	-	SCH,	CH,	(IA-Na-Salz)

Bsp	A	Q	R ¹	R ²	R ³	(Position)	R ⁵	R ⁶	(Formel) Physikal. Daten
62	CH ₂	0	C ₂ H ₅	Н	Cl	(2-) F	SCH ₃	CH ₃	(IB)
63	CH ₂	0	C ₂ H ₅	Н	CF ₃	-	Н	CH ₃	$\log P = 1,99^{*}$ (IA)
64	CH ₂	0	C ₂ H ₅	Н	CF ₃	-	CH ₃	CH ₃	(IA) $logP = 1,80^{a}$
65	CH ₂	0	C ₂ H ₅	Н	CF ₃	-	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	(IA) logP = 1,98 a)
66	CH ₂	0	C ₂ H ₅	Н	CF ₃	-	осн,	CH ₃	(IA) logP = 2,27 *)
67	CH ₂	0	C ₂ H ₅	Н	SO ₂ CH ₃	-	CF ₃	СН,	$(1A)$ $log P = 1,60^{-a}$
68	CH ₂	0	C₂H₅	Н	SO ₂ CH ₃	-	OCH ₂ CF ₃	CH ₃	(IA) logP = 1,73 a)
69	CH ₂	0	C ₂ H ₅	Н	F	(2-) CI	CH ₃	CH ₃	(IB) logP = 1,27 a)
70	CH ₂	0	C ₂ H ₅	Н	F	(2-) CI	SCH ₃	CH ₃	(IB) $\log P = 1.76^{a}$
71	CH ₂	0	C ₂ H ₅	Н	F	(2-) Cl	ОСН,	CH ₃	(IB) $\log P = 1,55^{a}$
72	CH ₂	0	C ₂ H ₅	Н	F	(2-) CI	N(CH ₃) ₂	СН,	(IB) $\log P = 1,62^{-4}$
73	СН₂	0	C ₂ H ₅	Н	SO ₂ CH ₃	(2-) CI	SCH ₃	СН,	(IB) Fp.: 204°C
74	CH₂	0	C ₂ H ₅	Н	SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	OCH,	СН,	(IB) Fp.: 183°C
75	CH₂	0	C ₂ H ₅	Н	SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	OCH ₂ CF ₃	СН3	(IB) Fp.: 192°C
76	CH ₂	0	C₂H₅	Н	SO ₂ CH ₃	(2-) CI	CH ₃	CH;	(IB) Fp.: 200°C
77	CH ₂	0	C₂H₅	Н	SO₂CH₃	(2-) CI	OCH,	\triangle	(IB) Fp.: 205°C

Bsp Nr.	A	Q	R ¹	R ²	R ³	(Posi- tion) (R ⁴) _n	R ⁵	R ⁶	(Formel) Physikal. Daten
78	CH ₂	0	C₂H₅	Н	SO ₂ CH ₃	(2-) CI	SCH ₃	\triangle	(IB) Fp.: 233°C
79	CH ₂	0	C₂H₅	Н	SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	CH ₃	\triangle	(IB) Fp.: 223°C
80	CH ₂	0	C₂H₅	Н	SO ₂ CH ₃	(2-) CI	C ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	(IB) Fp.: 163°C

- 74 -

Analog zu Beispiel 1 sowie entsprechend der allgemeinen Beschreibung des erfindungsgemäßen Herstellungsverfahrens können beispielsweise auch die in der nachstehenden Tabelle 2 aufgeführten Verbindungen der allgemeinen Formel (I) – bzw. der Formel (ID) - hergestellt werden.

5

<u>Tabelle 2:</u> Weitere Beispiele für die Verbindungen der Formel (I)

Bsp			(Position	(Position	(Position-)		T
Nr.	R ¹	R ²	-)	-)		Y	Physikal. Daten
			R³	$(R^4)_n$	-A-Z		Butch
ID-1	C ₂ H ₅	Н	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-)	Н	$\log P = 1,64^{*}$
					N CH,		
ID-2	C ₂ H ₅	Н	(2-) Cl	(4-) CI	(3-)	Н	logP = 1,77 a)
					N CH ₃		
ID-3	CH ₃	Н	(2-) Cl	(4-) CI	(3-)	Н	$\log P = 1,52^{a}$
					CH ₃		
ID-4	CH ₃	CH ₃	(2-) CI	(4-) Cl	(3-)	Н	$logP = 1,50^{-a}$
					N CH ₃		
ID-5	C ₂ H ₅	СН	(2-) CI	(4-) Cl	(3-)	Н	la - D 1 72 a)
	-23	, ,		(1) 61	N CH3		$\log P = 1,72^{-a}$
ID-6	t-C₄H ₉	СН,	(2-) CI	(4-) Cl	(3-)	Н	$logP = 3,01^{-a}$
					N CH ₃		
ID-7	C₂H₅	Н	(4-) CF ₃	-	(2-)	Н	$logP = 2,98^{a}$
					N S		
					N= SCH ₃		

Bsp Nr.	R¹	R ²	(Position -) R ³	(Position -) (R ⁴) _n	(Position-) -A-Z	Y	Physikal. Daten
ID-8	C₂H₅	Н	(4-) CF ₃	-	(2-) O CI	Н	logP = 2,75 a)
ID-9	C ₂ H ₅	Н	(4-) CF ₃	-	(2-) N CH OC ₂ H		logP = 3,82 ^{a)}
1D-10	C ₂ H ₅	Н	(4-) CF ₃	-	(2-) N CH		logP = 3,73 a)
ID-11	C₂H₅	Н	(4-) CF ₃	-	(2-) N C OC ₂		logP = 3,25 a)
ID-1:	2 C ₂ H ₅	Н	(4-) CF ₂	-	(2-) N = (SCH	SO ₂ CH ₃	logP = 2,82 *

Bsp Nr.	R'	R ²	(Position -)	(Position -) (R ⁴) _n	(Position-) -A-Z	Y	Physikal. Daten
ID-13	C₂H₅	Н	(4-) CF ₃	•	(2-) N CH ₃ OC ₂ H ₅	СН3	$logP = 2,74^{-a}$
1D-14	C₂H₅	Н	(4-) CF ₃	-	(2-) N CH ₃ OC ₂ H ₅	C₂H₅	$logP = 2,82^{a}$
ID-15	C₂H₅	Н	(4-) CF ₃	-	(2-) N CH ₃ OC ₂ H ₅	i-C₃H ₇	logP = 3,11 a)
ID-16	C₂H₅	Н	(4-) CF ₃	-	$(2-)$ $ \begin{array}{c} O\\ N\\ \end{array} $ $ \begin{array}{c} OC_2H_5 \end{array} $	CH ₂ HC CH ₂	logP = 2,99 a)
ID-17	C ₂ H ₅	Н	(4-) CF ₃	-	OC ₂ H ₅	CH ₂	logP = 3,45 °)

Bsp Nr.	R¹	R ²	(Position -)	(Position -) (R ⁴) _n	(Position-) -A-Z	Υ	Physikal. Daten
ID-18	C₂H,	Н	(4-) CF ₃		(2-) N — CH ₃ OC ₂ H ₅	CH ₂	logP = 3,79 a)
ID-19	C ₂ H ₅	Н	(4-) CF ₃		(2-) N CH ₃ OC ₂ H ₅	CH ₂	logP = 3,97 a)
ID-20	C ₂ H ₅	Н	(4-) CF ₃	-	(2-) N CH ₃ OC ₂ H ₅	CH ₂	logP = 3,12 a)
ID-21	C₂H₅	Н	(4-) CF ₃		(2-) N CH ₃ OC ₂ H ₅	CH ₂	logP = 3,49 a)
ID-22	C₂H₅	Н	(4-) CF ₃	_	(2-) N CH ₃ OC ₂ H ₅	CH ₂	logP = 3,85 a)

Dan			(Danisia)	(D::	(D :::)		T
Bsp Nr.	R¹	R ²	(Position	(Position	(Position-)	Y	Physikal. Daten
			\mathbb{R}^3		-A-Z	1	Daten
		<u> </u>		(R ⁴) _n			
ID-23	C ₂ H ₅	Н	(4-) CF ₃	-	OC ₂ H ₅	CH ₂	$logP = 4,26^{a}$
ID-24	C₂H₅	Н	(4-) CF ₃	-	(2-) N CH ₃ OC ₂ H ₅	CH ₂	$log P = 3,84^{-a}$
ID-25	C₂H₅	Н	(4-) CF ₃	-	OC ₂ H ₅	CH ₂	$logP = 3,33^{a}$
ID-26	C ₂ H ₅	Н	(4-) CF ₃	_	(2-) N CH ₃ OC₂H ₅	CH ₂	$\log P = 3.98^{a}$
ID-27	C₂H₅	Н	(4-) CF ₃	-	OC ₂ H ₅	CH ₂	$\log P = 3.94^{a}$

Bsp			(Position	(Position	(Position-)		Physikal.
Nr.	\mathbb{R}^1	R ²	-)	-)	-A-Z	Y	Daten
			R³	$(R^4)_n$	-A-2		
ID-28	C₂H₅	Н	(4-) CF ₃	-	(2-)	H ₂ C O	$logP = 3,57^{a}$
					N—N—CH ₃		
					`OC₂H₅		
						CH ₃	
ID-29	C₂H₅	Н	(4-) CF ₃	-	(2-)	H ₂ C O	$logP = 3,75^{a}$
					N CH ₃		
,					`OC₂H₅		
	<u> </u>					Cl	
ID-30	C ₂ H ₅	Н	(4-) CF ₃	-	(2-)	CH ₃	$logP = 2,65^{a}$
					N CH ₃		
					SCH ₃		
ID-31	C ₂ H ₅	Н	(4-) CF ₃	-	(2-)	C ₂ H ₅	$\log P = 2.71^{a}$
					N CH ₃		
					N=\ SCH ₃		
ID-32	C ₂ H ₅	Н	(4-) CF ₃	-	(2-)	i-C ₃ H ₇	$\log P = 3.00^{a}$
					N CH		
					SCH ₃		
	<u> </u>			<u> </u>		<u> </u>	

Bsp Nr.	R¹	R ²	(Position -) R ³	(Position -) (R ⁴) _n	(Position-) -A-Z	Y	Physikal. Daten
ID-33	C ₂ H ₅	Н	(4-) CF ₃	-	(2-) N CH ₃ SCH ₃	CH ₂ HC CH ₂	$log P = 2,89^{a}$
ID-34	C ₂ H ₅	Н	(4-) CF ₃	-	(2-) N CH ₃ SCH ₃	CH ₂	logP = 3,37 a)
ID-35	C₂H₅	Н	(4-) CF ₃	-	(2-) N CH ₃ SCH ₃	CH ₂	$logP = 3,71^{a}$
ID-36	C₂H,	Н	(4-) CF ₃	-	(2-) N N CH ₃ SCH ₃	CH ₂	logP = 3,89 a)
ID-37	C ₂ H ₅	Н	(4-) CF ₃	-	O N CH ₃ SCH ₃	CH ₂	$logP = 3,06^{a}$

Bsp Nr.	R¹	R ²	(Position -) R ³	(Position -) $(R^4)_n$	(Position-) -A-Z	Y	Physikal. Daten
ID-38	C ₂ H ₅	Н	(4-) CF ₃	-	(2-) 0 N — CH SCH ₃	CH ₂	logP = 3,41 a)
ID-39	C₂H,	Н	(4-) CF ₃	-	(2-) N CH SCH ₃		logP = 3,78 a)
ID-40	C ₂ H ₅	Н	(4-) CF ₃	-	(2-) N CH	CI	$logP = 4,17^{a}$
ID-41	C ₂ H ₅	Н	(4-) CF ₃	-	(2-) N C SCH	CH ₂	$\log P = 3,76^{a}$
ID-43	2 C ₂ H ₅	Н	(4-) CF ₃	-	(2-) N N SCH	CH ₂ NO ₂	logP = 3,26 °

D	 	T -	1/5	T		T	Υ
Bsp Nr.	R ¹	R ²	(Position	(Position	(Position-)	Y	Physikal.
	"	``	ľ		-A-Z	*	Daten
			R³	$(R^4)_n$			
ID-43	C ₂ H ₅	H	(4-) CF ₃	-	(2-)		$logP = 3.89^{a}$
					P	ÇH₂	
					N CH3		
					N N 0113		
					N=<		<u> </u>
					`SCH₃	ľ	
						ĊF₃	
ID-44	C ₂ H ₅	Н	(4) CE		(2.)		1 5 2 25 2)
1.0	2115	''	(4-) CF ₃	-	(2-)	Сн⁵	$\log P = 3,85^{a}$
]				N CH ₃		
					$N = \langle$	CF ₃	
	ŀ				SCH ₃	O. 3	
	1				Ĭ		
ID-45	C ₂ H ₅	Н	(4-) CF ₃	-	(2-)	1	$\log P = 3,19^{a}$
			,,,,,,		`´ ဂူ		.05. 3,.3
			1			H₂Ċ O	
		1			N CH3		
					N=		
ľ					`sch₃		
				:			
ID-46	C ₂ H ₅	Н	(4-) CF ₃	-	(2-)	1	$logP = 3,47^{a}$
					o l		0 ,
					N CH3	H ₂ C O	
					N N 113		
					N=<		
					`SCH₃		;
	!					CH ₃	
<u></u>		 				U113	
ID-47	C_2H_5	Н	(4-) CF	-	(2-)		$logP = 3,64^{a}$
					ii l	H ₂ C O	
		İ			N CH3	· Y	
					´ \ /		
					N— SCH ₃		j
					3CH ₃		1
						Y	
					İ	ĆI	1
					 		

Bsp Nr.	R'	R²	(Position -) R ³	(Position -) (R ⁴) _n	(Position-) -A-Z	Υ	Physikal. Daten
ID-48	C ₂ H ₅	Н	(2-) OCH ₃	(4-) CI	(3-)	Н	
ID-49	C₂H₅	Н	(2-) OCH ₃	(4-) Cl	(3-) O CH ₃	Н	
ID-50	СН,	Н	(2-) Cl	(4-) CI	(3-) N—CH ₃	Н	$logP = 1,41^{a}$
ID-51	СН3	СН3	(2-) CI	(4-) CI	(3-) N CH ₃	Н	logP = 1,38 a)
ID-52	C ₂ H ₅	CH ₃	(2-) CI	(4-) Cl	(3-) N_CH ₃	Н	logP = 1,56 a)
ID-53	t-C ₄ H ₉	СН,	(2-) CI	(4-) Cl	(3-) ON_CH ₃	Н	$\log P = 2{,}79^{a}$
ID-54	CH ₃	Н	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-) N C ₂ H ₅	Н	$\log P = 1.62^{a}$

Bsp Nr.	R ¹	R²	(Position -) R ³	(Position -) (R ⁴) _n	(Position-) -A-Z	Y	Physikal. Daten
ID-55	СН,	СН,	(2-) CI	(4-) CI	(3-) N_C ₂ H ₅	Н	logP = 1,57 a)
ID-56	C₂H₅	Н	(2-) CI	(4-) CI	(3-) N_C ₂ H ₅	Н	$log P = 1,88^{a}$
ID-57	C ₂ H ₅	СН₃	(2-) CI	(4-) CI	(3-) N_C ₂ H ₅	Н	$logP = 1,79^{a}$
ID-58	t-C₄H ₉	СН,	(2-) CI	(4-) CI	(3-) N_C ₂ H ₅	Н	logP = 3,15 a)

Die Bestimmung der in den Tabellen 1 und 2 angegebenenen logP-Werte erfolgte gemäß EEC-Directive 79/831 Annex V.A8 durch HPLC (High Performance Liquid Chromatography) an einer Phasenumkehrsäule (C 18). Temperatur: 43°C.

5

(a) Eluenten für die Bestimmung im sauren Bereich: 0,1% wässrige Phosphorsäure, Acetonitril; linearer Gradient von 10% Acetonitril bis 90% Acetonitril - entsprechende Messergebnisse sind in Tabelle 1 mit ^{a)} markiert.

10

(b) Eluenten für die Bestimmung im neutralen Bereich: 0,01-molare wässrige Phosphatpuffer-Lösung, Acetonitril; linearer Gradient von 10% Acetonitril bis 90% Acetonitril - entsprechende Messergebnisse sind in Tabelle 1 mit b) markiert.

Die Eichung erfolgte mit unverzweigten Alkan-2-onen (mit 3 bis 16 Kohlenstoffatomen), deren logP-Werte bekannt sind (Bestimmung der logP-Werte anhand der Retentionszeiten durch lineare Interpolation zwischen zwei aufeinanderfolgenden Alkanonen).

5

Die lambda-max-Werte wurden an Hand der UV-Spektren von 200 nm bis 400 nm in den Maxima der chromatographischen Signale ermittelt.

Ausgangsstoffe der Formel (III):

Beispiel (III-1)

5

4,5 g (15 mMol) 2-(3-Chlor-4-cyano-phenyl)-4-methyl-5-trifluormethyl-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-on werden in 80 ml 60%iger Schwefelsäure aufgenommen und die Mischung wird 6 Stunden unter Rückfluss erhitzt. Nach Abkühlen auf Raumtemperatur wird das kristallin angefallene Produkt durch Absaugen isoliert.

10

Man erhält 4,5 g (91% der Theorie) 2-(3-Carboxy-4-chlor-phenyl)-4-methyl-5-tri-fluormethyl-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-on vom Schmelzpunkt 223°C.

Beispiel (III-2)

15

$$\begin{array}{c|c} HO & O & O \\ \hline & N & -CH_3 \\ \hline & O-C_2H_5 \end{array}$$

20

2 g (4,9 mMol) 5-Brom-4-methyl-2-(2-ethoxycarbonyl-5-trifluormethyl-benzyl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-on (vgl. Beispiel IV-1) werden in 30 ml 10%iger ethanolischer Kalilauge gelöst und 2 Stunden unter Rückfluss erhitzt. Das Reaktionsgemisch wird im Wasserstrahlvakuum eingeengt, in 20 ml Wasser aufgenommen und

mit verdünnter Salzsäure angesäuert. Der ausfallende Feststoff wird filtriert und

- 88 -

getrocknet.

Man erhält 1,2 g (71% der Theorie) 5-Ethoxy-4-methyl-2-(2-carboxy-5-trifluor-methyl-benzyl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-on als festes Produkt.

logP: 2,18a)

Beispiel (III-3)

10

15

5

13,4 g (35 mMol) 4-Methyl-5-trifluormethyl-2-(2,6-dichlor-3-methoxycarbonyl-benzyl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-on werden in 60 ml 1,4-Dioxan vorgelegt und eine Lösung von 1,54 g (38,5 mMol) Natriumhydroxid in 20 ml Wasser wird bei Raumtemperatur langsam eindosiert. Die Reaktionsmischung wird 150 Minuten bei 60°C gerührt und anschließend im Wasserstrahlvakuum eingeengt. Der Rückstand wird in 100 ml Wasser gelöst und durch Zugabe von konz. Salzsäure wird der pH-Wert der Lösung auf 1 eingestellt. Das hierbei kristallin angefallene Produkt wird durch Absaugen isoliert.

20

Man erhält 11,7 g (90% der Theorie) 4-Methyl-5-trifluormethyl-2-(2,6-dichlor-3-carboxy-benzyl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-on vom Schmelzpunkt 207°C.

25

Analog zu den Beispielen (III-1) bis (III-3) können beispielsweise auch die in der nachstehenden Tabelle 3 aufgeführten Verbindungen der allgemeinen Formel (III) hergestellt werden.

HO
$$(R^4)_n$$

$$A - Z$$
(III)

Tabelle 32: Beispiele für die Verbindungen der Formel (III)

Bsp	(Position-)	(Position-)	(Position-)	Physikal. Daten
Nr.	R ³	$(R^4)_n$	-A-Z	
III-4	(4-) CI	_	(2-) N CH ₃ CH ₃	$logP = 1,39^{a}$
III-5	(4-) SO ₂ CH ₃	-	(3-) N N	logP = 1,47 a)
III-6	(4-) F	-	$N \longrightarrow N \longrightarrow CH_3$ $N \longrightarrow CH_3$ $N \longrightarrow CH_5$	logP = 1,73 a)
III-7	(4-) CF ₃	-	(2-) N=(Br	logP = 1,65 ^{a)}
III-8	(4-) Br	-	(2-) N CH ₃ N(CH ₃) ₂	logP = 1,74 a)

Bsp	(Position-)	(Position-)	(Position-)	Physikal. Daten
Nr.	R ³	$(R^4)_n$	-A-Z	
III-9	(4-) CF ₃	-	$\begin{array}{c c} & & & \\ & & & \\ & & & \\ & & & \\ & & & \\ & & & \\ & & & \\ & & & \\ & & & \\ & & & \\ & & & \\ & & & \\ & & & \\ & & & \\ & & \\ & & & \\ & &$	logP = 2,43 a)
III-10	(4-) CF ₃	-	(2-) N N C ₂ H ₅ OCH ₃	$logP = 2,12^{a}$
III-11	(4-) CF ₃	-	(2-) N CH ₃ CH ₃	$logP = 1,61^{-a}$
III-12	(4-) CF ₃	-	(2-) N CH ₃ N(CH ₃) ₂	$logP = 1,93^{a}$
III-13	(4-) CF ₃	-	(2-) N CH ₃ Br	$logP = 2,01^{a}$

Bsp	(Position-)	(Position-)	(Position-)	Physikal. Daten
Nr.	R ³	$(R^4)_n$	-A-Z	
III-14	(4-) CF ₃	-	(2-)	$logP = 1,77^{a}$
III-15	(3-) CH ₃	_	(2-)	$logP = 1,70^{a}$
			O N CH_3 OC_2H_5	
III-16	(4-) SO ₂ CH ₃		(2-)	$logP = 1,07^{a}$
			N—CH ₃	
III-17	(4-) CF ₃	-	(2-)	$\log P = 2.35^{a}$
			$ \begin{array}{c} $	
III-18	(4-) CF ₃	-	(2-)	$\log P = 2,63^{a}$
			N—————————————————————————————————————	

Bsp	(Position-)	(Position-)	(Position-)	Physikal. Daten
Nr.	\mathbb{R}^3	$(R^4)_n$	-A-Z	
III-19	(4-) CF ₃	-	(2-)	$logP = 2,13^{a}$
			NNN	
			N=OCH ₃	
III-20	(4-) CF ₃	-	(2-)	$\log P = 1.82^{\text{ a)}}$
111-20	(1) 013		Q.	
			$\backslash N \backslash N $	
			N=(
711 21	(4) CF		(2)	$logP = 2,48^{a}$
III-21	(4-) CF ₃	-	(2-)	10g1 2,10
			N CH ₃	
			N=(
			`OCH₂CF	3
777 00	(4) OF		(2-)	$\log P = 1,73^{a}$
III-22	(4-) CF ₃	-	0	1051 1,75
			N CH ₃	
			H₃C O	
III-23	(4-) CF ₃	-	0	$logP = 3,11^{a}$
			N	
			N=(CF	3
			(2-)	3

Bsp	(Position-)	(Position-)	(Position-)	Physikal. Daten
Nr.	R ³	$(R^4)_n$	-A-Z	
III-24	(4-) F	-	(2-) N CH ₃	$logP = 1,43^{a}$
III-25	(4) E		N=(CH ₃) ₂	
	(4-) F	-	OC ₃ H ₇ -n	logP = 1,97 a)
III-26	(4-) F	-	(2-) N— CH ₂ OCH ₃	$logP = 1,30^{a}$
III-27	(4-) F	-	(2-) N N OCH ₃	$logP = 1,63^{a}$
III-28	(4-) F		$\begin{array}{c c} (2-) & & \\ & & $	$logP = 1,93^{a}$

Bsp	(Position-)	(Position-)	(Position-)	Physikal. Daten
Nr.	R ³	$(R^4)_n$	-A-Z	
III-29	(4-) CF ₃	-	(2-) O CH ₃ CH ₃ CH ₃	logP = 1,78 a)
III-30	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-) N CH ₃ SCH ₃	Fp.: 230°C logP = 1,63 a)
III-31	(2-) Cl	(4-) CI	(3-) N CH ₃ OC ₂ H ₅	Fp.: 190°C logP = 1,73 a)
III-32	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-) N	Fp.: 210°C logP = 1,87 a)
III-33	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-) OCH ₃	Fp.: 210°C logP = 1,43 a)

Nr. R^3 $(R^4)_n$ -A-Z IIII-34 (2-) Cl (4-) Cl (3-) Fp.: 164°C logP = 2,01°a°) IIII-35 (2-) Cl (4-) Cl (3-) Fp.: 168°C logP = 2,04°a°) IIII-36 (2-) Cl (4-) Cl (3-) Fp.: 218°C logP = 1,53°a°) IIII-37 (2-) Cl (4-) Cl (3-) Fp.: 259°C logP = 0,98°a°) IIII-38 (2-) Cl (4-) Cl (3-) Fp.: 259°C logP = 0,98°a°)	Bsp	(Position-)	(Position-)	(Position-)	Physikal. Daten
$\begin{array}{c ccccccccccccccccccccccccccccccccccc$	Nr.	\mathbb{R}^3	$(R^4)_n$	-A-Z	
III-35 (2-) Cl (4-) Cl (3-) Fp.: 168°C logP = 2,04 a) OCH ₂ CF ₃ III-36 (2-) Cl (4-) Cl (3-) Fp.: 218°C logP = 1,53 a) III-37 (2-) Cl (4-) Cl (3-) Fp.: 259°C logP = 0,98 a) III-38 (2-) Cl (4-) Cl (3-) Fp.: 210°C	III-34	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-)	Fp.: 164°C
III-35 (2-) Cl (4-) Cl (3-) Fp.: 168°C $\log P = 2.04^{-3}$ III-36 (2-) Cl (4-) Cl (3-) Fp.: 218°C $\log P = 1.53^{-3}$ III-37 (2-) Cl (4-) Cl (3-) Fp.: 259°C $\log P = 0.98^{-3}$ III-38 (2-) Cl (4-) Cl (3-) Fp.: 210°C				ပူ	$\log P = 2.01^{-a}$
III-35 (2-) CI (4-) CI (3-) Fp.: 168° C $\log P = 2,04^{-3}$ III-36 (2-) CI (4-) CI (3-) Fp.: 218° C $\log P = 1,53^{-3}$ III-37 (2-) CI (4-) CI (3-) Fp.: 259° C $\log P = 0,98^{-3}$ III-38 (2-) CI (4-) CI (3-) Fp.: 210° C				N CH3	
III-35 (2-) CI (4-) CI (3-) Fp.: 168° C $\log P = 2,04^{-3}$ III-36 (2-) CI (4-) CI (3-) Fp.: 218° C $\log P = 1,53^{-3}$ III-37 (2-) CI (4-) CI (3-) Fp.: 259° C $\log P = 0,98^{-3}$ III-38 (2-) CI (4-) CI (3-) Fp.: 210° C				N=(
$III-36 (2-) \text{ Cl} \qquad (4-) \text{ Cl} \qquad (3-) \qquad Fp.: 218^{\circ}\text{C} \\ logP = 1,53^{\circ}) \\ III-37 (2-) \text{ Cl} \qquad (4-) \text{ Cl} \qquad (3-) \qquad Fp.: 259^{\circ}\text{C} \\ logP = 0,98^{\circ}) \\ III-38 (2-) \text{ Cl} \qquad (4-) \text{ Cl} \qquad (3-) \qquad Fp.: 210^{\circ}\text{C}$					
III-36 (2-) Cl (4-) Cl (3-) Fp.: 218°C $\log P = 1,53$ a) III-37 (2-) Cl (4-) Cl (3-) Fp.: 259°C $\log P = 0,98$ a) III-38 (2-) Cl (4-) Cl (3-) Fp.: 210°C	III-35	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-)	
$\begin{array}{c ccccccccccccccccccccccccccccccccccc$				l Q	$logP = 2,04^{a}$
III-36 (2-) Cl (4-) Cl (3-) Fp.: 218°C $\log P = 1,53$ a) Br III-37 (2-) Cl (4-) Cl (3-) Fp.: 259°C $\log P = 0,98$ a) III-38 (2-) Cl (4-) Cl (3-) Fp.: 210°C				N CH ₃	
III-36 (2-) Cl (4-) Cl (3-) Fp.: 218°C $\log P = 1,53$ a) Br III-37 (2-) Cl (4-) Cl (3-) Fp.: 259°C $\log P = 0,98$ a) III-38 (2-) Cl (4-) Cl (3-) Fp.: 210°C				N=	
$\begin{array}{c ccccccccccccccccccccccccccccccccccc$				OCH ₂ CF ₃	
$\begin{array}{c ccccccccccccccccccccccccccccccccccc$	III-36	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-)	Fp.: 218°C
III-37 (2-) CI (4-) CI (3-) Fp.: 259°C $\log P = 0.98^{a}$ H III-38 (2-) CI (4-) CI (3-) Fp.: 210°C				Q	1
III-37 (2-) CI (4-) CI (3-) Fp.: 259°C $\log P = 0.98^{a}$ H III-38 (2-) CI (4-) CI (3-) Fp.: 210°C				N CH ₃	
III-37 (2-) CI (4-) CI (3-) Fp.: 259°C $\log P = 0.98^{a}$ III-38 (2-) CI (4-) CI (3-) Fp.: 210°C				N=(
O O O O O O O O O O				Br	
III-38 (2-) Cl (4-) Cl (3-) Fp.: 210°C	III-37	(2-) CI	(4-) Cl	(3-)	Fp.: 259°C
III-38 (2-) Cl (4-) Cl (3-) Fp.: 210°C				0	$\log P = 0.98^{a}$
III-38 (2-) Cl (4-) Cl (3-) Fp.: 210°C				N CH3	
III-38 (2-) Cl (4-) Cl (3-) Fp.: 210°C				N=(
	TTI 20	(2.) (1	(4.) (1		F 2109C
	111-38	(2-) CI	(4-) CI	(3-)	
				Ĭ GU	logr – 1,50
N CH ₃				N N N	
				1	

Bsp	(Position-)	(Position-)	(Position-)	Physikal. Daten
Nr.	R ³	$(R^4)_n$	-A-Z	
III-39	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-)	Fp.: 197°C
			Q	$\log P = 1.51^{a}$
			N CH ₃	
			\ \ \n=\	
			N(CH ₃) ₂	
III-40	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-)	Fp.: 262°C
	l.		0	$\log P = 1.11^{a}$
			N CH ₃	
			N=(
			,CH3	
III-41	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-)	Fp.: 249°C
			Q	$logP = 1,30^{a}$
			N N	
			N=()	
				20000
III-42	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-)	Fp.: 200°C
				$\log P = 1.71^{a}$
	•		N N	
			N=(OCH ₃	
				10000
III-43	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-)	Fp.: 189°C
				$logP = 2,01^{a}$
			N N	
			N=(
			OC ₂ H ₅	

Bsp	(Position-)	(Position-)	(Position-)	Physikal. Daten
Nr.	R ³	$(R^4)_n$	-A-Z	
III-44	(2-) CI	(4-) Cl	(3-)	Fp.: 178°C
			N OC ₃ H ₇ -i	$logP = 2,28^{a}$
III-45	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-)	Fp.: 161°C
			N OCH ₂ CF ₃	$logP = 2,31^{a}$
III-46	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-)	Fp.: 200°C
			N SCH ₃	logP = 1,98 ^{a)}
III-47	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-)	Fp.: 201°C
			N CH ₃	$logP = 1,39^{a}$
III-48	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-)	Fp.: 207°C
			N N (CH ₃) ₂	logP = 1,77 a)

Bsp	(Position-)	(Position-)	(Position-)	Physikal. Daten
Nr.	\mathbb{R}^3	$(R^4)_n$	-A-Z	
III-49	(2-) CI	(4-) CI	(3-)	Fp.: 140°C
			Q	$\log P = 1.88^{a}$
			N OC ₂ H ₅	
			N=(
:			C ₂ H ₅	
ŀ				
III-50	(4-)	-	(2-)	Fp.: 154°C
	OCH ₂ CHF ₂) P	$\log P = 2.14^{a}$
			N CH ₃	
			N=(
			CF ₃	
III-51	-	-	(2-)	Fp.: 214°C
			Q	$\log P = 1.87^{a}$
			N	
III-52	-	-		Fp.: 194°C
			N N	$logP = 2,07^{a}$
			(2-)	
III-53		-		Fp.: 181°C
111-33	-	-	(2-)	$logP = 1,97^{a}$
			, J , CI	10gr - 1,97
			N Y	
			Ċι	
III-54	-	-	S _{II}	Fp.: 251°C
			N N NH	$\log P = 1.14^{\text{ a}}$
			(2-)	
1	1	1		

Bsp	(Position-)	(Position-)	(Position-)	Physikal. Daten
Nr.	R ³	$(R^4)_n$	-A-Z	a Alfonian Buton
III-55	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-) N CH ₃	$logP = 1,38^{a}$
III-56	(2-) CI	(4-) Cl	(3-) O N CH ₃	$\log P = 1,48^{\text{ a}}$
III-57	(2-) CI	(4-) CI	(3-) SO ₂	
III-58	(4-) Cl	-	(2-) N—CH ₃ CF ₃	¹ H-NMR (DMSO-D6, δ): 5,42 ppm.
III-59	(4-) CF ₃	_	(2-) N CH ₃ CH ₃	'H-NMR (DMSO-D6, δ): 5,48 ppm.
III-60	(4-) CF ₃	-	(2-) N CH ₃ CF ₃	'H-NMR (DMSO-D6. δ): 5.60 ppm. logP = 2.47 a)

Bsp	(Position-)	(Position-)	(Position-)	Physikal. Daten
Nr.	R³	(R ⁴) _n	-A-Z	
III-61	(4-) CF ₃	-	(2-)	$logP = 2,33^{a}$
			N N	
III-62	(4-) SO ₂ CH ₃	-	(3-)	'H-NMR
			O	(DMSO-D6, δ):
			N CH ₃	5.14 ppm.
III-63	(4-) SO ₂ CH ₃	-	(2-)	'H-NMR
			l o	(DMSO-D6, δ):
			N CH ₃	5,27 ppm.
111-64	(4-) Cl	-	(3-)	¹H-NMR
			O	(CDCl ₃ , δ):
			N—CH ₃	5,12 ppm.
III-65	(4-) Cl	-	(3-)	'H-NMR
			0	(DMSO-D6, δ):
			N—CH ₃ CF ₃	5.20 ppm.

Bsp	(Position-)	(Position-)	(Position-)	Physikal. Daten
Nr.	\mathbb{R}^3	$(R^4)_n$	-A-Z	
III-66	(4-) CI	-	(2-)	'H-NMR
			0	(DMSO-D6, δ):
			N	5,03 ppm.
) N=(
III-67	(4-) Br	-	(2-)	¹H-NMR
			Q	(DMSO-D6, δ):
			N OC ₂ H ₅	5,24 ppm.
			N=(
			C ₂ H ₅	
III-68	(4-) Br		(2-)	'H-NMR
111-00	(4-) Di		0	(DMSO-D6, δ):
			N CH ₃	5,39 ppm.
			N=\N=\N=\N=\N=\N=\N=\N=\N=\N=\N=\N=\N=\N	PP
			CF ₃	
III-69	(4-) F	-	(2-)	'H-NMR
				(DMSO-D6, δ):
			N CH ₃	5,19 ppm.
			N=	
			`OC ₂ H ₅	
III-70	(4-) F	-	(2-)	'H-NMR
			0	(DMSO-D6, δ):
			N N CH ₃	5,30 ppm.
			N=(SCH ₃	
			30113	

Bsp	(Position-)	(Position-)	(Position-)	Physikal. Daten
Nr.	\mathbb{R}^3	(R ⁴) _n	-A-Z	
III-71	(4-) F	-	(2-)	'H-NMR
			Q	(DMSO-D6, δ):
			N CH3	5,43 ppm.
			N=(
			`SO₂CH₃	
III-72	(4-) Br	-	(3-)	'H-NMR,
			o I	$ (CDCl_3 \delta): $
			N CH3	5,10 ppm.
			N=	
			,CH³	
III-73	(4-) Br	-	(3-)	¹H-NMR
			0	(DMSO-D6, δ):
			N CH ₃	5,03 ppm.
) N=<	
			OC ₂ H ₅	
III-74	(4-) Br	-	(3-)	'H-NMR
				(DMSO-D6, δ):
			N CH ₃	5,19 ppm.
		,	N=<	
			ČF₃	
III-75	(4-) Br	-	(2-)	'H-NMR
				(DMSO-D6, δ):
			N N	5,01 ppm.
			N=	
	<u></u>			

Bsp	(Position-)	(Position-)	(Position-)	Physikal. Daten
Nr.	R ³	(R ⁴) _n	-A-Z	
III-76	(4-) Cl	-	(2-)	'H-NMR
) P	(DMSO-D6, δ):
			N N N	5,14 ppm.
			OC ₂ H ₅	
III-77	(4-) CI	-	(2-)	¹H-NMR
			O II	(DMSO-D6, δ):
			$N \rightarrow N \rightarrow C_2H_5$	5,25 ppm.
			C ₂ H ₅	
III-78	(4-) NO ₂	-	(2-)	'H-NMR
				(DMSO-D6, δ):
			N N N	5,23 ppm.
			OC ₂ H ₅	
III-79	(4-) NO ₂	-	(2-)	'H-NMR
			P	(DMSO-D6, δ):
			N CH ₃	5,37 ppm.
			N= SCH₃	
III-80	(4-) CF ₃	-	(2-)	$\log P = 2.46^{\text{ a}}$
			\searrow_{N}	
			N= OC ₂ H ₅	
			2' '5	

Bsp	(Position-)	(Position-)	(Position-)	Physikal. Daten
Nr.	\mathbb{R}^3	$(R^4)_n$	-A-Z	
III-81	(4-) CF ₃	-	(2-)	'H-NMR
			O	(DMSO-D6, δ):
			N OC ₂ H ₅	5,31 ppm.
			N=(
			C ₂ H ₅	
III-82	(4-) CF ₃	-	(2-)	$logP = 2,08^{a}$
			N—CH ₃	
			N= SCH ₃	
III-83	(4-) OCH ₃	-	(2-)	H-NMR
				(CDCl ₃ , δ):
			N CH ₃	5,38 ppm.
]		N= OC₂H₅	
	141	_		¹H-NMR
III-84	(4-) OCH ₃	-	(2-)	1
				$(CDCl_3, \delta)$:
			N OC ₂ H ₅	5,43 ppm.
			N= C₂H₅	
III-85	(4-) CF ₃	-	(2-)	¹H-NMR
			Q	(CDCl ₃ , δ):
			N CH ₃	5,47 ppm.
			N=(
			CH ₂ OCH	13

Bsp	(Position-)	(Position-)	(Position-)	Physikal. Daten
Nr.	R ³	$(R^4)_n$	-A-Z	
III-86	(4-) Br	-	(2-) N=N-	logP = 1,44 a)
III-87	(4-) Br	-	(2-) N=N	$logP = 1,63^{a}$
III-88	(4-) Br	-	OC ₃ H ₇ -i	logP = 2,27 a)
III-89	(4-) Br	-	(2-) O N — CH ₃ N — OC ₃ H ₇ -n	$log P = 2,31^{a}$
III-90	-	-	(2-) N CH ₃ CF ₃	$\log P = 1.82^{a}$

WO 00/58306 PCT/EP00/02292

Bsp	(Position-)	(Position-)	(Position-)	Physikal. Daten
Nr.	R ³	$(R^4)_n$	-A-Z	
III-91	(4-) Br	-	(2-)	¹H-NMR
			l o	(CDCl ₃ , δ):
		}	N CH ₃	5,32 ppm.
			N=(
		•	OC ₂ H ₅	
III-92	(4-) Br	-	(2-)	¹ H-NMR
			Q I	(CDCl ₃ , δ):
			N CH3	5,53 ppm.
			N=	
			CF ₃	
III-93	(4-) F	-	(2-)	'H-NMR
				$(CDCl_3, \delta)$:
			N CH ₃	5,39 ppm.
			N=	
			OC₂H₅	
III-94	(4-) F	-	(2-)	'H-NMR
				(CDCl ₃ , δ):
			N N CH ₃	5,57 ppm.
			N=CF ₃	
111.05				lu Na Co
III-95	(4-) F	-	(2-)	'H-NMR
				(CDCl ₃ , δ):
			N OC ₂ H ₅	5,44 ppm.
			C_2H_5	
L				

Bsp	(Position-)	(Position-)	(Position-)	Physikal. Dater
Nr.	R ³	$(R^4)_n$	-A-Z	
III-96	(4-) F	-	(2-)	'H-NMR
			O	(CDCl ₃ , δ)
			N N CH ₃	5,41 ppm.
			N=(
			OCH ₃	
III-97	-	-	(2-)	'H-NMR
) 	(CDCl ₃ , δ):
			N CH3	5,34 ppm.
			N=	
VII. 00			OC ₂ H ₅	
III-98	-	-	(2-)	¹ H-NMR
			Q II	(CDCl ₃ , δ):
			N CH ₃	5,38 ppm.
			N=(OCH ₃	
III-99	-			
III	_	-	(2-)	'H-NMR
				(CDCl ₃ , δ):
			NNN	5,26 ppm.
			N=	
III-100	-	-	(2-)	'H-NMR
			O II	(CDCl ₃ , δ):
			N-CH3	5,43 ppm.
			$N = \langle$	
			`SCH₃	

Bsp	(Position-)	(Position-)	(Position-)	Physikal. Daten
Nr.	\mathbb{R}^3	$(R^4)_n$	-A-Z	
III-101	-	-	(2-)	$logP = 1,23^{a}$
			N CH ₃ SO ₂ CH ₃	
III-102	(4-) SO ₂ CH ₃	-	(2-)	$\log P = 1,14^{a}$
			$ \begin{array}{c} O \\ N = \\ OC_2H_5 \end{array} $	
III-103	(4-) CF ₃	-	(2-)	$logP = 2,45^{a}$
			$ \begin{array}{c} O\\ N \end{array} $ $ \begin{array}{c} OC_3H_7-i\\ \end{array} $	
III-104	(4-) CF ₃	-	(2-)	$\log P = 2,48^{a}$
			$ \begin{array}{c} $	ח
ПІ-105	(4-) Br	-	(2-)	$\log P = 1,85^{a}$
			N CH ₃	

Bsp	(Position-)	(Position-)	(Position-)	Physikal. Daten
Nr.	\mathbb{R}^3	(R ⁴) _n	-A-Z	
III-106	(4-) CF ₃	-	(3-)	$\log P = 2,74^{a}$
			OC ₃ H ₇ -i	
III-107	(4-) CF ₃	-	(2-)	$logP = 2,01^{a}$
			N CH ₂ OCH ₃	
III-108	(4-) CF ₃	-	(2-)	$logP = 1,79^{a}$
			N CH ₂ OCH ₃	
III-109	(4-) CF ₃	-	(2-)	$logP = 1,65^{a}$
			N—CH ₃ Br	
III-110	(4-) Br	-	(2-)	$logP = 1,90^{a}$
			N—CH ₃ SCH ₃	

Bsp	(Position-)	(Position-)	(Position-)	Physikal. Daten
Nr.	R ³	$(R^4)_n$	-A-Z	
III-111	(4-) CI	-	(2-) N CH ₃ SCH ₃	$\log P = 1,83^{a}$
III-112	(4-) I	-	(2-) N CH ₃ OC ₂ H ₅	$logP = 2,06^{a}$
III-113	(4-) I	-	(2-) N CH ₃ CF ₃	Fp.: 104°C logP = 2,39 a)
111-114	(4-) Br	-	(2-)	Fp.: 191°C
III-11:	5 (4-) Br	-	(2-) N _N	Fp.: 213°C

Bsp	(Position-)	(Position-)	(Position-)	Physikal. Daten
Nr.	R ³	$(R^4)_n$	-A-Z	
III-116	-	-	(2-)	
III-117	-	-	(2-)	Fp.: 112°C
			O N-CH ₃ CF ₃	
III-118	(4-) CF ₃		(2-)	Fp.: 158°C
			O N—CH ₃ CF ₃	
III-119	(4-) CF ₃	-	(2-)	Fp.: 162°C
			N N N	
III-120	(4-) Cl	(5-) Cl	(2-)	Fp.: 167°C
			N CH ₃	

Bsp	(Position-)	(Position-)	(Position-)	Physikal. Daten
Nr.	\mathbb{R}^3	$(R^4)_n$	-A-Z	
Ш-121	-	•	N CH ₃	Fp.: 188°C
III-122	-	-	(2-) N	
III-123	-	-	CH ₃	Fp.: 131°C
III-124	(4-) Cl	-	(2-) N CH ₃ CF ₃	Fp.: 109°C
III-125	(4-) I	-	(2-) O N CH ₃ CF ₃	Fp.: 104°C
III-126	6 (4-) Br	-	(2-) N CH ₃ CF ₃	Fp.: 99°C

Bsp	(Position-)	(Position-)	(Position-)	Physikal. Daten
Nr.	R ³	$(R^4)_n$	-A-Z	
III-127	(4-) Br	-	(2-) N=N	Fp.: 174°C
III-128	_	_	(2-) N N CH ₃ SCH ₃	Fp.: 122°C
III-129	(4-) Br		(2-) O N CH ₃ SCH ₃	Fp.: 164°C
III-130	-		$\begin{array}{c c} (2-) & O \\ N & CH_3 \\ N & OC_3H_7-i \end{array}$	Fp.: 154°C
III-131	(4-) Br	-	(2-) N CH ₃ N CC ₃ H ₇ -i	Fp.: 161°C

Bsp	(Position-)	(Position-)	(Position-)	Physikal. Daten
Nr.	\mathbb{R}^3	(R ⁴) _n	-A-Z	
III-132	(4-) CN	-	(2-) N CH ₃ CF ₃	Fp.: 196°C
III-133	-		(2-) O N N N N N N N N N N N N N N N N N N	Fp.: 192°C
III-134	-	_	O H	

Die Bestimmung der in Tabelle 3 angegebenenen logP-Werte erfolgte gemäß EEC-Directive 79/831 Annex V.A8 durch HPLC (High Performance Liquid Chromatography) an einer Phasenumkehrsäule (C 18). Temperatur: 43°C.

5

(a) Eluenten für die Bestimmung im sauren Bereich: 0,1% wässrige Phosphorsäure, Acetonitril; linearer Gradient von 10% Acetonitril bis 90% Acetonitril - entsprechende Messergebnisse sind in Tabelle 1 mit ^{a)} markiert.

10

(b) Eluenten für die Bestimmung im neutralen Bereich: 0,01-molare wässrige Phosphatpuffer-Lösung, Acetonitril; linearer Gradient von 10% Acetonitril bis 90% Acetonitril - entsprechende Messergebnisse sind in Tabelle 1 mit b) markiert.

15

Die Eichung erfolgte mit unverzweigten Alkan-2-onen (mit 3 bis 16 Kohlenstoffatomen), deren logP-Werte bekannt sind (Bestimmung der logP-Werte anhand der WO 00/58306 PCT/EP00/02292

- 115 -

Retentionszeiten durch lineare Interpolation zwischen zwei aufeinanderfolgenden Alkanonen).

Die lambda-max-Werte wurden an Hand der UV-Spektren von 200 nm bis 400 nm in den Maxima der chromatographischen Signale ermittelt.

5

PCT/EP00/02292

Ausgangsstoffe der Formel (IV):

Beispiel (IV-1)

5

10 10 g (49 mMol) 2-Methyl-4-trifluormethyl-benzoesäure werden in 150 ml Ethanol gelöst und mit 1 ml konz. Schwefelsäure versetzt. Nach 24 Stunden Erhitzen unter Rückfluss wird die Lösung eingeengt, in Methylenchlorid aufgenommen und mit gesättigter wässriger Natriumhydrogencarbonat-Lösung extrahiert. Die Methylenchlorid-Phase wird über Natriumsulfat getrocknet und im Wasserstrahlvakuum eingeengt.

Man erhält 9 g (80% der Theorie) 2-Methyl-4-trifluormethyl-benzoesäure-ethylester als amorphen Rückstand.

PCT/EP00/02292 WO 00/58306

- 117 -

Stufe 2

9 g (39 mMol) 2-Methyl-4-trifluormethyl-benzoesäure-ethylester werden in 200 ml 5 Tetrachlormethan gelöst und mit 7 g (39 mMol) N-Brom-succinimid und 0.1 g Dibenzoylperoxid versetzt. Nach 6 Stunden Erhitzen unter Rückfluss wird das abgeschiedene Succinimid abfiltriert und das Filtrat im Wasserstrahlvakuum eingeengt.

Man erhält 12 g eines amorphen Rückstandes, der neben 2-Brommethyl-4-trifluor-10 methyl-benzoesäure-ethylester 17 % 2,2-Dibrommethyl-4-trifluormethylnoch benzoesäure-ethylester und 12% 2-Methyl-4-trifluormethyl-benzoesäure-ethylester enthält.

15 Stufe 3

20

4 g 2-Brommethyl-4-trifluormethyl-benzoesäure-ethylester (ca. 70%ig) und 2.28 g (12,8 mMol) 5-Brom-4-methyl-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-on werden in 150 ml Acetonitril gelöst, mit 5.3 g (38,4 mMol) Kaliumcarbonat versetzt und unter kräftigem Rühren 2 Stunden zum Rückfluss erhitzt. Das Reaktionsgemisch wird in Wasser aufgenommen und mit Methylenchlorid mehrfach extrahiert. Die gesammelten Methylenchlorid-Phasen werden über Natriumsulfat getrocknet, im Wasserstrahlvakuum eingeengt und chromatographiert.

Man erhält 2 g (38 % der Theorie) 5-Brom-4-methyl-2-(2-ethoxycarbonyl-5-trifluor-methyl-benzyl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-on als amorphes Produkt.

¹H-NMR (CDCl₃, δ): 5,46 ppm.

Beispiel (IV-2)

10

15

20

25

5

6,7 g (40 mMol) 4-Methyl-5-trifluormethyl-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-on werden in 150 ml Acetonitril vorgelegt und mit 11 g (80 mMol) Kaliumcarbonat verrührt. Nach Erwärmen der Mischung auf 50°C wird dann eine Lösung von 13,1 g (44 mMol) 3-Brommethyl-2,4-dichlor-benzoesäure-methylester in 20 ml Acetonitril unter Rühren tropfenweise dazu gegeben und die Reaktionsmischung wird noch 15 Stunden unter Rühren zum Rückfluss erhitzt. Anschließend wird im Wasserstrahlvakuum eingeengt, der Rückstand in Methylenchlorid aufgenommen, mit 1N-Salzsäure gewaschen, mit Natriumsulfat getrocknet und filtriert. Das Filtrat wird unter vermindertem Druck eingeengt, der Rückstand mit Petrolether digeriert und das kristallin angefallene Produkt durch Absaugen isoliert.

Man erhält 14,9 g (97% der Theorie) 4-Methyl-5-trifluormethyl-2-(2,6-dichlor-3-methoxycarbonyl-benzyl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-on vom Schmelzpunkt 109°C.

Analog zu den Beispielen (IV-1) und (IV-2) können beispielsweise auch die in der nachstehenden Tabelle 4 aufgeführten Verbindungen der allgemeinen Formel (IV) hergestellt werden.

$$X \xrightarrow{(R^4)_n} A Z \qquad (IV)$$

PCT/EP00/02292 WO 00/58306

- 120 -

<u>Tabelle 4</u>: Beispiele für die Verbindungen der Formel (IV)

Bsp	(Position-)	(Position-)	(Position-)		Physikal.
Nr.	\mathbb{R}^3	$(R^4)_n$	-A-Z	X	Daten
IV-3	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-)	OCH,	Fp.: 229°C
			N CH ₃		$logP = 2,27^{a}$
T3.7. 4	(2)(1	(4-) Cl	(3-)	OCH ₃	Fp.: 120°C
IV-4	(2-) Cl	(4-) 61	Q Q		$logP = 2,38^{a}$
			N CH ₃ OC ₂ H ₅		
IV-5	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-)	OCH ₃	Fp.: 127°C
			N N N		$logP = 2,55^{a}$
IV-6	(2-) Cl	(4-) CI	(3-)	OCH ₃	1
			OCH ₃		$\log P = 2.04^{a}$
IV-7	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-)	OCH,	1
			OC ₃ H		$logP = 2.73^{a}$

Bsp	(Position-)	(Position-)	(Position-)		Physikal.
Nr.	R ³	$(R^4)_n$	-A-Z	X	Daten
IV-8	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-)	OCH ₃	Fp.: 129°C
			ON_CH ₃		$\log P = 2,72^{a}$
			N= OCH₂CF	3	
IV-9	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-)	OCH ₃	Fp.: 164°C
			O II	-	$\log P = 2.18^{a}$
			N CH ₃		
IV-10	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-)	OCH ₃	Fp.: 158°C
			O II		$logP = 1,55^{a}$
			N CH ₃		
IV-11	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-)	OCH ₃	Fp.: 106°C
					$\log P = 2,16^{a}$
			N—CH ₃		
IV-12	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-)	OCH ₃	Fp.: 126°C
			N CH ₃		$\log P = 2.11^{a}$
			N=\(\(\text{N}\)\(\text{CH}_3\)_2		
			11(3.13/2		

Bsp	(Position-)	(Position-)	(Position-)		Physikal.
Nr.	\mathbb{R}^3	$(R^4)_n$	-A-Z	X	Daten
IV-13	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-)	OCH ₃	Fp.: 146°C
			N—CH ₃		$\log P = 1,65^{a}$
IV-14	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-)	OCH ₃	Fp.: 178°C
			Q		$logP = 1,86^{a}$
			N=N		
IV-15	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-)	OCH ₃	Fp.: 97°C
			OCH ₃		$logP = 2,36^{a}$
IV-16	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-)	OCH ₃	Fp.: 99°C
			N N N N N N N N N N		$logP = 2,73^{a}$
IV-17	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-)	OCH ₃	Fp.: 56°C
			OC ₃ H ₇	-i	$\log P = 3.08^{a}$

Bsp	(Position-)	(Position-)	(Position-)		Physikal.
Nr.	R ³	$(R^4)_n$	-A-Z	X	Daten
IV-18	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-)	OCH ₃	Fp.: 102°C
			OCH ₂ CF ₃		$logP = 3,05^{a}$
IV-19	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-)	OCH ₃	Fp.: 131°C
			N SCH ₃		$logP = 2,70^{a}$
IV-20	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-)	OCH ₃	Fp.: 135°C
1 1 2 2 3	(2-) 61		O N N CH ₃	OC113	logP = 1,97 a)
IV-21	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-)	OCH ₃	Fp.: 143°C
			N N N N CH ₃) ₂		logP = 2,42 a)
IV-22	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-)	OCH ₃	Fp.: 85°C
			$ \begin{array}{c} O \\ N \\ O \\ O \\ C_2H_5 \end{array} $		logP = 2,58 a)

Bsp	(Position-)	(Position-)	(Position-)		Physikal.
Nr.	R ³	(R ⁴) _n	-A-Z	x	Daten
IV-23	(2-) CI	(4-) Cl	(3-) O	OCH ₃	$logP = 1,98^{a}$
			N CH ₃		
IV-24	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-)	OCH ₃	$logP = 2,07^{a}$
			N CH ₃	-	
IV-25	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-)	OCH ₃	Fp.: 157°C
1. 25			Q		$\log P = 2.94^{a}$
			N SO ₂		
IV-26	(4-) CF ₃	-	(2-)	OC ₂ H ₅	'H-NMR
			Q		(CDCl ₃ , δ):
			N CH ₃		5,53 ppm.
			`SO₂CH		
IV-27	(4-) NO ₂	-	(3-)	OC ₂ H ₅	l.
			0		$(CDCl_3, \delta)$:
			N CH ₃		5,48 ppm.
IV-28	(4-) NO ₂	-	(3-)	OC ₂ H,	'H-NMR
			9		$(CDCl_3, \delta)$
			N N		5,30 ppm.

Bsp	(Position-)	(Position-)	(Position-)		Physikal.
Nr.	R³	(R ⁴) _n	-A-Z	x	Daten
IV-29	(4-) SO ₂ CH ₃	-	(3-)	OC ₂ H ₅	¹H-NMR
			Q		(CDCl ₃ , δ):
			N CH ₃		5,61 ppm.
			N=(
			CF ₃		
IV-30	(4-) Cl	-	(3-)	OC ₂ H ₅	¹H-NMR
			Q		(CDCl ₃ , δ):
			N CH ₃		5,08 ppm.
			N=		
			CH₃		
IV-31	(4-) Cl	-	(3-)	OC ₂ H ₅	'H-NMR
					(CDCl ₃ , δ):
			N CH ₃		5,17 ppm.
			N=		
			CF ₃		
IV-32	(4-) Cl	-	(3-)	OC ₂ H ₅	'H-NMR
			l o		(CDCl ₃ , δ):
			N		5,00 ppm
			N=(
IV-33	(4-) SO ₂ CH ₃	-	0	OC ₂ H ₅	$logP = 1,53^{a}$
				23	<i>G</i> ,
			(2-)		
	<u> </u>	<u></u>			

Bsp	(Position-)	(Position-)	(Position-)		Physikal.
Nr.	R ³	$(R^4)_n$	-A-Z	X	Daten
IV-34	(4-) Br	-	(2-)	OC ₂ H ₅	$\log P = 3.24^{a}$
			$ \begin{array}{c c} & O \\ & N - OC_2H_5 \\ & C_2H_5 \end{array} $		
IV-35	(4-) Br	-	(2-)	OC ₂ H ₅	$\log P = 3,40^{a}$
			N CH ₃		
IV-36	(4-) F	-	(3-)	OC ₂ H ₅	$logP = 2,41^{a}$
			N CH ₃		
IV-37	(4-) F	-	(2-)	OC ₂ H ₅	$logP = 2,45^{a}$
		-	N CH ₃		
IV-38	(4-) Br	-	(3-)	OC ₂ H	$\log P = 2.06^{a}$
			N=CH ₃		

Bsp	(Position-)	(Position-)	(Position-)		Physikal.
Nr.	R ³	$(R^4)_n$	-A-Z	X	Daten
IV-39	(4-) Br		(3-) N CH ₃ Br	OC ₂ H ₅	$log P = 2,64^{a}$
IV-40	(4-) Br	-	(3-) N CH ₃ CF ₃	OC ₂ H ₅	$logP = 3,23^{a}$
IV-41	(4-) Br	-	(3-) N	OC ₂ H ₅	$logP = 3,02^{a}$
IV-42	(4-) Cl		$\begin{array}{c c} (2-) & & \\ & & $	OC ₂ H ₅	logP = 3,23 a)
IV-43	(4-) Cl		(2-) N CF ₃	OC₂H₅	$logP = 3,31^{-a}$

Bsp	(Position-)	(Position-)	(Position-)		Physikal.
Nr.	\mathbb{R}^3	(R ⁴) _n	-A-Z	X	Daten
IV-44	(4-) Cl	-	(2-)	OC ₂ H ₅	$logP = 3,14^{a}$
			$ \begin{array}{c c} & O \\ & N - OC_2H_5 \\ & C_2H_5 \end{array} $		
IV-45	(4-) NO ₂	-	(2-)	OC ₂ H ₅	$logP = 2,42^{a}$
			$ \begin{array}{c c} & O \\ & N \\ & O \\$		
IV-46	(4-) NO ₂	-	(2-)	OC ₂ H ₅	$logP = 2,82^{a}$
			N—CH ₃		
IV-47	(4-) CF ₃	-	(2-)	OC ₂ H ₅	$\log P = 3,48^{a}$
			$\begin{array}{c c} & O \\ & N \\ & OC_2H_5 \end{array}$		
IV-48	(4-) CF ₃	-	(2-)	OC ₂ H ₅	$logP = 3,38^{a}$
			$ \begin{array}{c} O \\ N \\ O \\ C_2H_5 \end{array} $		

Bsp	(Position-)	(Position-)	(Position-)		Physikal.
Nr.	\mathbb{R}^3	(R ⁴) _n	-A-Z	X	Daten
IV-49	(4-) CF ₃	-	(2-) O N CH ₃ SCH ₃	OC₂H₅	$logP = 3,02^{a}$
IV-50	(4-) CF ₃		(2-) N N OC ₂ H ₅	OC ₃ H ₇	logP = 3,91 a)
IV-51	(4-) OCH ₃	-	(2-) N CH ₃ N=	OC₂H₅	
IV-52	(4-) OCH ₃	-	$\begin{array}{c c} (2-) & & \\ & & $	OC₂H₅	
IV-53	(4-) CF ₃	-	(2-) N CH ₃ N OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	'H-NMR (CDCl ₃ , δ): 5,37 ppm.

Bsp	(Position-)	(Position-)	(Position-)		Physikal.
Nr.	\mathbb{R}^3	$(R^4)_n$	-A-Z	x	Daten
IV-54	(4-) CF ₃	-	(2-)	OC ₂ H ₅	'H-NMR
			Q		(CDCl ₃ , δ):
			N CH ₃		5,37 ppm.
			N=(
			OCH3	i	
IV-55	-	-	(2-)	OC ₂ H ₅	
			Q.		
			N CH ₃		
			N=(
			OC ₂ H ₅		
IV-56	-	-	(2-)	OC ₂ H ₅	¹H-NMR
			l o		(CDCl ₃ , δ):
			N CH ₃		5,37 ppm.
			N=(
			,OCH³		
IV-57	-		(2-)	OC ₂ H ₅	'H-NMR
Ì			Q		(CDCl ₃ , δ):
			N OC21	H ₅	5,40 ppm.
			N=		
			C ₂ H ₅		
IV-58	(4-) Br	-	(2-)	OC₂H	$\log P = 2.95^{a}$
			P		
			N N CH	3	
			N=		
			OC ₂ H	5	

Bsp	(Position-)	(Position-)	(Position-)		Physikal.
Nr.	R ³	$(R^4)_n$	-A-Z	X	Daten
IV-59	(4-) Br	-	(2-)	OC ₂ H ₅	'H-NMR
			l o		(CDCl ₃ , δ):
			N—CH ₃		5,31 ppm.
			OCH ₃		
IV-60	(4-) Br	-		OC ₂ H ₅	$\log P = 2,44^{a}$
			(2-) O		
IV-61	(4-) F		(2-)	OC₂H₅	'H-NMR
			0		$(CDCl_3, \delta)$:
			N CH ₃		5,35 ppm.
			N=\		* **
			OC ₂ H ₅		i
IV-62	(4-) F	-	(2-)	OC ₂ H ₅	¹H-NMR
			e e		$(CDCl_3, \delta)$:
			N CH3		5,53 ppm.
			N=		
			CF ₃		
IV-63	(4-) F	-	(2-)	OC ₂ H ₅	H-NMR
					$(CDCl_3, \delta)$:
			N OC ₂ H ₅		5,40 ppm.
			N = C₂H₅		
IV-64	(4-) F	-	(2-)	OC ₂ H ₅	¹H-NMR
			Q Q		$(CDCl_3, \delta)$:
			N CH ₃		5,36 ppm.
			N=(
			, ОСН ³		

Bsp	(Position-)	(Position-)	(Position-)		Physikal.
Nr.	R ³	$(R^4)_n$	-A-Z	X	Daten
IV-65	(4-) Br	-	(2-)	OC ₂ H ₅	$\log P = 3.34^{\text{ a}}$
			OC ₃ H ₇ -i		
IV-66	(4-) Br	-	(2-)	OC ₂ H ₅	$\log P = 3.38^{a}$
			$N = CH_3$ $N = CH_3$ OC_3H_7-n		
IV-67	(4-) Br		(2-)	OC₂H,	$\log P = 3.31^{a}$
			OCH ₂ CF	= 3	
IV-68	(4-) Br	-	(2-)	OC ₂ H ₅	$logP = 2,16^{a}$
			N N N		
IV-69	(4-) Br	-	(2-)	OC ₂ H	$\log P = 2.41^{a}$
			N N		

Bsp	(Position-)	(Position-)	(Position-)		Physikal.
Nr.	\mathbb{R}^3	$(R^4)_n$	-A-Z	X	Daten
IV-70	(4-) CF ₃	-	(2-) O	OC ₂ H ₅	$\log P = 3,51^{a}$
			$N \longrightarrow CH_3$ OC_3H_7-i		
IV-71	(4-) CF ₃	-	(2-)	OC ₂ H ₅	$logP = 3,54^{a}$
			OC ₃ H ₇ -n		
IV-72	(4-) Br	-	Q Q	OC ₂ H ₅	$\log P = 2.36^{a}$
			(2-)		
IV-73	(4-) Br	-	N N N N N N N N N N N N N N N N N N N	OC₂H₅	$logP = 2,88^{a}$
137.74	(4) OF		(2-) CH ₃		
IV-74	(4-) CF ₃	-	(2-) O N CH ₃	OC₂H₅	$\log P = 2,68^{a}$
			H		
IV-75	(4-) Br	-	(2-)	OC ₂ H ₅	$logP = 2.80^{a}$
			N CH ₃		

Bsp	(Position-)	(Position-)	(Position-)		Physikal.
Nr.	R³	$(R^4)_n$	-A-Z	x	Daten
IV-76	(4-) CF ₃	-	(3-) N N OCH ₃	OC ₂ H ₅	logP = 3,87 a)
IV-77	(4-) CF ₃	-	(2-) N= CH ₂ OCI	OC ₂ H ₅	logP = 2,88 a)
IV-78	(4-) CF ₃	-	(2-) N—CH ₃ CH ₂ OC	OC ₂ H ₅	$logP = 2,60^{a}$
IV-79	(4-) CF ₃	-	(2-) N N Br	OC ₂ H ₅	$logP = 3,35^{a}$
IV-80	(4-) Br	-	(2-) N CH ₃ SCH ₃	OC ₂ H ₅	logP = 2,86 a)

Bsp	(Position-)	(Position-)	(Position-)	<u> </u>	Physikal.
Nr.	R ³	(R ⁴) _n	-A-Z	X	Daten
IV-81	(4-) Cl	_	(2-)	OC ₂ H ₅	$logP = 2,83^{a}$
			N—CH ₃		
IV-82	(4-) Br	-	(2-)	OC ₂ H ₅	$logP = 2,60^{a}$
			N=CH ₃ N(CH ₃) ₂		
IV-83	(4-) CF ₃	-	(2-)	OC ₂ H ₅	¹H-NMR
			Q		(CDCl ₃ , δ):
			$ \begin{array}{c c} & & \\$		5,36 ppm.
IV-84	(4-) CF ₃	-	(2-)	OC ₂ H ₅	¹H-NMR
			O O		(CDCl ₃ , δ):
			$ \begin{array}{c c} & & \\$		5,37 ppm.
IV-85	(4-) CF ₃	-	(2-)	OC ₂ H ₅	$\log P = 2,79^{a}$
			$ \begin{array}{c c} & O \\ & N \\ & N \\ & N \\ & N \\ & N \\ & N \\ & N \\ & O \\ & N \\$		

Bsp	(Position-)	(Position-)	(Position-)		Physikal.
Nr.	R ³	$(R^4)_n$	-A-Z	X	Daten
IV-86	(4-) CF ₃	-	(2-)	OC ₂ H ₅	$logP = 3,67^{a}$
IV-87	(4-) CF ₃	-	(2-) Q	OC ₂ H ₅	$\log P = 3,80^{a}$
				-	
IV-88	(3-) CH ₃	-	(2-) N CH ₃ OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	$logP = 2,54^{a}$
IV-89	(4-) SO ₂ CH ₃	-	(2-) N CH ₃ SCH ₃	OC ₂ H ₅	
IV-90	(4-) CF ₃	-	(2-) O N N O CF ₃	OC ₂ H	$\log P = 2.93^{\text{ a}}$

Bsp	(Position-)	(Position-)	(Position-)		Physikal.
Nr.	\mathbb{R}^3	(R ⁴) _n	-A-Z	X	Daten
IV-91	(4-) CF ₃		(2-) N N OCH ₃	OC ₂ H ₅	$\log P = 3.08^{a}$
IV-92	(4-) CF ₃	_	(2-) CH ₃	OC ₂ H ₅	$\log P = 3.04^{a}$
IV-93	(4-) CF ₃	-	(2-) N N CH ₃ OCH ₂ CF ₃	OC₂H₅	$logP = 3,45^{a}$
IV-94	(4-) F	-	(2-) N— N—CH ₃ N(CH ₃) ₂	OC ₂ H ₅	logP = 2,21 a)
IV-95	(4-) F	-	OC ₃ H ₇ -n	OC₂H₅	$logP = 2.96^{a}$

Bsp	(Position-)	(Position-)	(Position-)		Physikal.
Nr.	\mathbb{R}^3	(R⁴) _n	-A-Z	X	Daten
IV-96	(4-) F	-	(2-) N— CH ₂ OCH		logP = 2,05 a)
IV-97	(4-) F		(2-) N N OCH ₃		logP = 2,50 a)
IV-98	(4-) F	-	(2-) N N OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	$\log P = 2.89^{a}$
IV-99	(4-) CF ₃	-	(2-) O CH ₃ CH ₃ CH ₃	OC ₂ H ₅	$logP = 2,91^{a}$
IV-100	(4-) CI	-	(2-) N CH ₃ CH ₃	OC ₂ H ₅	'H-NMR (CDCl ₃ , δ): 5,39 ppm.

Bsp	(Position-)	(Position-)	(Position-)		Physikal.
Nr.	R ³	(R ⁴) _n	-A-Z	X	Daten
IV-101	(4-) Cl	-	(2-)	OC ₂ H ₅	¹H-NMR
			Q Q		(CDCl ₃ , δ):
			N CH ₃		5,50 ppm.
			N=(
			CF ₃	:	
IV-102	(4-) Cl	-	(2-)	OC ₂ H ₅	'H-NMR
			Q		$(CDCl_3, \delta)$:
			N CH ₃		5,49 ppm.
			N=		
			`SO ₂ CH ₃		
IV-103	(4-) CF ₃	-	(2-)	OC ₂ H ₅	H-NMR
			o o		(CDCl ₃ , δ):
			N CH ₃		5,29 ppm.
į			N=<		
			CH₃		
IV-104	(4-) CF ₃	-	(2-)	OC ₂ H ₅	'H-NMR
			0		$(CDCl_3, \delta)$:
			N CH ₃		5,53 ppm.
			N=(
			CF ₃		
IV-105	(4-) CF ₃	-	(2-)	OC ₂ H ₅	'H-NMR
					$(CDCl_3, \delta)$:
			N N		5,34 ppm.
			N=		
L	1	1		<u> </u>	1

Bsp	(Position-)	(Position-)	(Position-)		Physikal.
Nr.	\mathbb{R}^3	$(R^4)_n$	-A-Z	X	Daten
IV-106	(4-) SO ₂ CH ₃	-	(2-)	OC ₂ H ₅	TH-NMR
			O A		(CDCl ₃ , δ):
			NNN		5,39 ppm.
			N=		
IV-107	(4-) SO ₂ CH ₃	-	(2-)	OC ₂ H ₅	'H-NMR
			Q		(CDCl ₃ , δ):
			N CH ₃		5,43 ppm.
			N=(
			,CH ³	Ì	
IV-108	(4-) SO ₂ CH ₃	-	(2-)	OC ₂ H ₅	'H-NMR
			P		(CDCl ₃ , δ):
			N CH ₃	İ	5,40 ppm.
			N=		
			N(CH ₃) ₂		
IV-109	(4-) SO ₂ CH ₃	-	(2-)	OC ₂ H ₅	TH-NMR
			Q	į	$(CDCl_3, \delta)$:
			N CH ₃		5,38 ppm.
			N=		
			`OC₂H₅		
IV-110) (4-) Br	1-	(2-)	OC ₂ H ₅	
			O O		(CDCl ₃ , δ):
			N CH ₃		5,49 ppm.
			N=		
			CF ₃		

Bsp	(Position-)	(Position-)	(Position-)		Physikal.
Nr.	\mathbb{R}^3	$(R^4)_n$	-A-Z	X	Daten
IV-111	-	-	(2-)	OC ₂ H ₅	¹H-NMR
			Q A		(CDCl ₃ , δ):
			N		5,3 ppm.
) N=(
IV-112	-	-	(2-)	OC ₂ H ₅	'H-NMR
			ဂူ		(CDCl ₃ , δ):
			N CH ₃		5,44 ppm.
			N=		
			`SCH₃		
IV-113	(4-) CF ₃	-	(2-)	OC ₂ H ₅	$logP = 2,58^{a}$
			0		
			N N CH3		
			N-		
			н₃с′ "о		
IV-114	(4-) SO ₂ CH ₃	-	(2-)	OCH ₃	$\log P = 1,53^{a}$
			N N CH ₃		
			N=(
137 115	(4.) 00. 611		SCH ₃	OGY	1 5 1 50 3
IV-115	(4-) SO ₂ CH ₃	-	(2-)	OCH ₃	$\log P = 1.59^{a}$
			N N CH ₃		
			N= OC,H ₅		
			2 - 2 - 75		

Bsp	(Position-)	(Position-)	(Position-)		Physikal.
Nr.	\mathbb{R}^3	(R ⁴) _n	-A-Z	Х	Daten
IV-116	(4-) I	-	(2-)	OCH ₃	$logP = 2,68^{a}$
			ON CH ₃		
			N = OC ₂ H ₅		
IV-117	(4-) CF ₃	-	(2-)	OCH ₃	$\log P = 2.74^{a}$
1 4 - 1 1 7	(4-) 013		Q Q		
			N CH ₃		
			OC ₂ H ₅		
IV-118	(4-) CF ₃	-	(2-)	OCH ₃	$\log P = 2,65^{a}$
			O N CH ₃		
			N=\SCH ₃		
IV-119	(4-) CF ₃	-	(2-)	OC ₂ H ₅	$\log P = 2.96^{a}$
			N CH ₃		
IV-120) -	-	(2-)	OCH ₃	Fp.: 106°C
			O CH		
			H ₃ C O		
			1130		

Die Bestimmung der in Tabelle 4 angegebenenen logP-Werte erfolgte gemäß EEC-Directive 79/831 Annex V.A8 durch HPLC (High Performance Liquid Chromatography) an einer Phasenumkehrsäule (C 18). Temperatur: 43°C.

WO 00/58306 - 143 -

PCT/EP00/02292

(a) Eluenten für die Bestimmung im sauren Bereich: 0,1% wässrige Phosphorsäure, Acetonitril; linearer Gradient von 10% Acetonitril bis 90% Acetonitril - entsprechende Messergebnisse sind in Tabelle 1 mit a) markiert.

5

(b) Eluenten für die Bestimmung im neutralen Bereich: 0,01-molare wässrige Phosphatpuffer-Lösung, Acetonitril; linearer Gradient von 10% Acetonitril bis 90% Acetonitril - entsprechende Messergebnisse sind in Tabelle 1 mit b) markiert.

10

Die Eichung erfolgte mit unverzweigten Alkan-2-onen (mit 3 bis 16 Kohlenstoffatomen), deren logP-Werte bekannt sind (Bestimmung der logP-Werte anhand der Retentionszeiten durch lineare Interpolation zwischen zwei aufeinanderfolgenden Alkanonen).

15

Die lambda-max-Werte wurden an Hand der UV-Spektren von 200 nm bis 400 nm in den Maxima der chromatographischen Signale ermittelt.

- 144 -

Anwendungsbeispiele:

Beispiel A

Pre-emergence-Test

5

15

Lösungsmittel:

5 Gewichtsteile Aceton

Emulgator:

1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel, gibt die angegebene
Menge Emulgator zu und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte
Konzentration.

Samen der Testpflanzen werden in normalen Boden ausgesät. Nach ca. 24 Stunden wird der Boden so mit der Wirkstoffzubereitung besprüht, dass die jeweils gewünschte Wirkstoffmenge pro Flächeneinheit ausgebracht wird. Die Konzentration der Spritzbrühe wird so gewählt, dass in 1000 Liter Wasser pro Hektar die jeweils gewünschte Wirkstoffmenge ausgebracht wird.

Nach drei Wochen wird der Schädigungsgrad der Pflanzen bonitiert in % Schädigung im Vergleich zur Entwicklung der unbehandelten Kontrolle.

Es bedeuten:

25 0 %

30

keine Wirkung (wie unbehandelte Kontrolle)

100 % = totale Vernichtung

In diesem Test zeigen beispielsweise die Verbindungen gemäß Herstellungsbeispiel 2 und 3 bei guter Verträglichkeit gegenüber Kulturpflanzen, wie z.B. Mais. starke Wirkung gegen Unkräuter.

- 145 -

Beispiel B

Post-emergence-Test

5 Lösungsmittel:

5 Gewichtsteile Aceton

Emulgator:

1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel, gibt die angegebene Menge Emulgator zu und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Mit der Wirkstoffzubereitung spritzt man Testpflanzen, welche eine Höhe von 5 - 15 cm haben so, dass die jeweils gewünschten Wirkstoffmengen pro Flächeneinheit ausgebracht werden. Die Konzentration der Spritzbrühe wird so gewählt, dass in 1000 l Wasser/ha die jeweils gewünschten Wirkstoffmengen ausgebracht werden.

Nach drei Wochen wird der Schädigungsgrad der Pflanzen bonitiert in % Schädigung im Vergleich zur Entwicklung der unbehandelten Kontrolle.

20

10

15

Es bedeuten:

0 % = keine Wirkung (wie unbehandelte Kontrolle)

100 % = totale Vernichtung

25

In diesem Test zeigen beispielsweise die Verbindung gemäß Herstellungsbeispiel 2 und 3 starke Wirkung gegen Unkräuter.

Patentansprüche

1. Substituierte Benzoylpyrazole der allgemeinen Formel (I),

$$\begin{array}{c|c}
R^{2} & O \\
N & A \\
R^{1} & R^{3}
\end{array}$$
(I)

5

in welcher

n für die Zahlen 0, 1, 2 oder 3 steht,

10

A für eine Einfachbindung oder für Alkandiyl (Alkylen) steht,

R¹ für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkinyl oder Cycloalkyl steht,

15

für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkoxycarbonyl oder Cycloalkyl steht,

20

für Wasserstoff, Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylamino, Dialkylamino oder Dialkylaminosulfonyl steht,

25

für Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylamino, Dialkylamino oder Dialkylaminosulfonyl steht, 5

30

- Y für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxycarbonyl, Alkylsulfonyl, Alkylaminocarbonyl, Dialkylaminocarbonyl, Alkenyl, Alkenylcarbonyl, Alkenylsulfonyl, Alkinyl, Alkinylcarbonyl, Cycloalkyl, Cycloalkyl, Cycloalkyl, Cycloalkyl, Phenylcarbonyl, Phenylsulfonyl, Phenylalkyl oder Phenylcarbonylalkyl steht, und
- für eine gegebenenfalls substituierte 4- bis 12-gliedrige, gesättigte oder ungesättigte, monocyclische oder bicyclische, heterocyclische Gruppierung steht, welche 1 bis 4 Heteroatome (bis zu 4 Stickstoffatome und gegebenenfalls alternativ oder additiv ein Sauerstoffatom oder ein Schwefelatom, oder eine SO-Gruppierung oder eine SO2-Gruppierung) enthält, und welche zusätzlich ein bis drei Oxo-Gruppen (C=O) und/oder Thioxo-Gruppen (C=S) als Bestandteile des Heterocyclus enthält.

einschließlich aller möglichen tautomeren Formen und der möglichen Salze.

- 20 2. Verbindungen gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß
 - n für die Zahlen 0, 1 oder 2 steht,
- A für eine Einfachbindung oder für Alkandiyl (Alkylen) mit 1 bis 4

 Kohlenstoffatomen steht,
 - für gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Halogen. C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkyl-carbonyl, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl, C₁-C₄-Alkylsulfinyl oder C₁-C₄-Alkylsulfonyl substituiertes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy-

carbonyl substituiertes Alkenyl oder Alkinyl mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen, oder für gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,

5

R² für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkoxy oder Alkoxycarbonyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen, für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkylthio mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, oder für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkyl substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,

10

R³ für Wasserstoff, Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfinyl oder C₁-C₄-Alkylsulfonyl substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils bis zu 4 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, oder für Alkylamino, Dialkylamino oder Dialkylaminosulfonyl mit jeweils bis zu 4 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen steht,

20

15

für Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfinyl oder C₁-C₄-Alkylsulfonyl substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils bis zu 4 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen. oder für Alkylamino, Dialkylamino oder Dialkylaminosulfonyl mit jeweils bis zu 4 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen steht,

25

30

Y für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano. Carboxy. Carbamoyl, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxycarbonyl substituiertes Alkyl,

5

10

15

20

Alkylcarbonyl oder Alkoxycarbonyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkylsulfonyl, Alkylaminocarbonyl oder Dialkylaminocarbonyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl substituiertes Alkenyl, Alkenylcarbonyl, Alkinyl oder Alkinylcarbonyl mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen, für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkenylsulfonyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkyl substituiertes Cycloalkyl, Cycloalkylcarbonyl oder Cycloalkylalkyl mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Cycloalkylgruppen und gegebenenfalls 1 bis 3 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, oder für jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy substituiertes Phenylcarbonyl, Phenylsulfonyl, Phenyl-C₁-C₄-alkyl oder Phenylcarbonyl-C₁-C₄-alkyl steht, und

Z für eine der nachstehenden heterocyclischen Gruppierungen steht

 \mathbb{R}^{5} \mathbb{R}^{5} \mathbb{R}^{5} \mathbb{R}^{5} \mathbb{R}^{5} \mathbb{R}^{5} \mathbb{R}^{5} \mathbb{R}^{5} \mathbb{R}^{5}

- 151 -

worin jeweils die gestrichelt gezeichnete Bindung eine Einfachbindung oder eine Doppelbindung ist,

Q für Sauerstoff oder Schwefel steht,

 R^5

10

5

15

20

25

30

für Wasserstoff, Hydroxy, Mercapto, Cyano, Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfinyl oder C₁-C₄-Alkylsulfonyl substituiertes Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxy, Alkoxycarbonyl, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, für Propadienylthio, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkylamino oder Dialkylamino mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkenyl, Alkinyl, Alkenyloxy, Alkenylthio oder Alkenylamino mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen in den Alkenyl- bzw. Alkinylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Cyclo-Cycloalkyloxy, Cycloalkylthio, Cycloalkylamino, Cycloalkylalkyl, Cycloalkylalkoxy, Cycloalkylalkylthio oder Cycloalkylalkylamino mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Cycloalkylgruppen und gegebenenfalls bis zu 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Phenyl, Phenyloxy, Phenylthio, Phenylamino, Benzyl, Benzyloxy, Benzylthio oder Benzylamino steht, für Pyrrolidino, Piperidino oder Morpholino steht, oder - für den Fall, daß zwei benachbarte Reste R⁵ und R⁵ sich an einer Doppelbindung befinden - zusammen mit dem benachbarten Rest R⁵ auch für eine Benzogruppierung steht, und

R6

5

10

15

20

30

für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, Alkylidenamino mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen oder C1-C4-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylamino, Dialkylamino oder Alkanoylamino mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkenyl, Alkinyl oder Alkenyloxy mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen in den Alkenyl- bzw. Alkinylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl oder Cycloalkylamino mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Cycloalkylgruppen und gegebenenfalls bis zu 3 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Phenyl oder Benzyl steht, oder zusammen mit einem benachbarten Rest R⁵ oder R⁶ für gegebenenfalls durch Halogen oder C1-C4-Alkyl substituiertes Alkandiyl mit 3 bis 5 Kohlenstoffatomen steht,

wobei die einzelnen Reste R⁵ und R⁶ - soweit mehrere davon an gleiche heterocyclische Gruppierungen gebunden sind, gleiche oder verschiedene Bedeutungen im Rahmen der obigen Definition haben können.

- 25 3. Verbindungen gemäß Anspruch 1 oder 2, dadurch gekennzeichnet, daß
 - n für die Zahlen 0 oder 1 steht,
 - A für eine Einfachbindung, Methylen, Ethyliden (Ethan-1.1-diyl) oder Dimethylen (Ethan-1,2-diyl) steht.

R1 für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, noder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfonyl, sulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n- oder i-Propylsulfonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Propenyl, Butenyl, Propinyl oder Butinyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Ethyl substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl steht,

- 153 -

10

5

WO 00/58306

für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Ethyl substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl steht,

20

25

30

15

für Wasserstoff, Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, Iod, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Methylthio, Ethylthio. n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, oder für Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, oder für Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, oder für Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, oder für Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, oder für Methylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, hylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Dimethylaminosulfonyl oder Diethylaminosulfonyl steht,

5

 R^4

 R^5

10

15

20

25

30

für Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, oder für Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Diethylaminosulfonyl oder Diethylaminosulfonyl steht,

für Wasserstoff, Hydroxy, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Difluormethyl, Dichlormethyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Chlordifluormethyl, Fluordichlormethyl, Fluorethyl, Chlorethyl, Difluorethyl, Dichlorethyl, Fluor-n-propyl, Fluor-i-propyl, Chlor-n-propyl, Chlor-i-propyl, Methoxymethyl, Ethoxymethyl, Methoxyethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Fluorethoxy, Chlorethoxy, Difluorethoxy, Dichlorethoxy, Trifluorethoxy, Trichlorethoxy, Chlorfluorethoxy, Chlordifluorethoxy, Fluordichlorethoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Fluorethylthio, Chlordifluorethylthio, Fluordichlorethylthio, Chlordifluorethylthio, Fluordichlorethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfonyl, Dimethylamino, Propenylthio, Butenylthio, Propinylthio, Butinylthio,

- 155 -

Cyclopropyl, Cyclopropylmethyl, Cyclopropylmethoxy, Phenyl oder Phenoxy steht,

5

R6

Y

für Amino, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, Methylamino, Dimethylamino, Cyclopropyl oder Cyclopropylmethyl steht, oder zusammen mit R⁵ für Propan-1,3-diyl (Trimethylen), Butan-1,4-diyl (Tetramethylen) oder Pentan-1,5-diyl (Pentamethylen) steht, und

10

15

20

für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Acetyl, Propionyl, n- oder i-Butyroyl, Methoxycarbonyl oder Ethoxycarbonyl, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor und/oder Brom substituiertes Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, n-, i-, s- oder t-Butylsulfonyl, Methylaminocarbonyl, Ethylaminocarbonyl, n- oder i-Propylaminocarbonyl, Dimethylaminocarbonyl oder Diethylaminocarbonyl, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Propenyl, Butenyl, Propenylcarbonyl, Butenylcarbonyl, Propenylsulfonyl, Butenylsulfonyl, Propinyl, Butinyl, Propinylcarbonyl oder Butinylcarbonyl, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methyl oder Ethyl substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopropylcarbonyl, Cyclobutylcarbonyl, Cyclopentylcarbonyl, Cyclohexylcarbonyl, Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl oder Cyclohexylmethyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Difluormethoxy oder Trifluormethoxy substituiertes Phenyl-

carbonyl, Phenylsulfonyl, Benzyl oder Phenylcarbonylmethyl steht.

- 4. Verbindungen gemäß einem der Ansprüche 1 bis 3, dadurch gekennzeichnet, daß
 - Z für die folgende Gruppierung steht

5

$$\begin{array}{c}
N \\
N \\
N \\
R^{6}
\end{array}$$

5. Verbindungen gemäß einem der Ansprüche 1 bis 4, dadurch gekennzeichnet, daß

10

- Q für Sauerstoff steht.
- 6. Verbindungen gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5, dadurch gekennzeichnet, daß n für 0 steht.

15

- 7. Verfahren zum Herstellen von Verbindungen gemäß einem der Ansprüche 1 bis 6, dadurch gekennzeichnet, daß man
 - (a) Pyrazole der allgemeinen Formel (II)

20

in welcher

R¹, R² und Y die in einem der Ansprüche 1 bis 3 angegebene Bedeutung haben,

25

mit substituierten Benzoesäuren der allgemeinen Formel (III),

HO
$$(R^4)_n$$

$$A Z$$

$$(III)$$

in welcher

5

n, A, R³, R⁴ und Z die in einem der Ansprüche 1 bis 6 angegebene Bedeutung haben,

10

in Gegenwart eines Dehydratisierungsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart eines oder mehrerer Reaktionshilfsmittel und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

oder daß man

15

(b) Pyrazole der allgemeinen Formel (II)

in welcher

20

R¹, R² und Y die in einem der Ansprüche 1 bis 3 angegebene Bedeutung haben,

mit substituierten Benzoesäurederivaten der allgemeinen Formel (IV)

- 158 -

$$X \xrightarrow{(R^4)_n} A Z$$
 R^3
(IV)

in welcher

5

10

15

20

n, A, R³, R⁴ und Z die in einem der Ansprüche 1 bis 6 angegebene Bedeutung haben, und

X für Cyano, Halogen oder Alkoxy steht,

- oder mit entsprechenden Carbonsäureanhydriden -

gegebenenfalls in Gegenwart eines oder mehrerer Reaktionshilfsmittel und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

oder daß man

(c) substituierte Benzoylpyrazole der allgemeinen Formel (Ia)

in welcher

n, A, R¹, R², R³, R⁴ und Z die in einem der Ansprüche 1 bis 6 angegebene Bedeutung haben,

mit Verbindungen der allgemeinen Formel (V)

10

15

20

25

H-Y (V)

in welcher

Y mit Ausnahme von Wasserstoff die in einem der Ansprüche 1 bis 4 angegebene Bedeutung hat,

- oder gegebenenfalls mit entsprechenden Isocyanaten oder Isothiocyanaten -

gegebenenfalls in Gegenwart eines oder mehrerer Reaktionshilfsmittel und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

und gegebenenfalls im Anschluß daran an den so erhaltenen Verbindungen der Formel (I) im Rahmen der Substituentendefinition auf übliche Weise elektrophile oder nucleophile bzw. Oxidations- oder Reduktionsreaktionen durchführt oder die Verbindungen der Formel (I) auf übliche Weise in Salze überführt.

8. Verbindungen der allgemeinen Formel (Ia)

$$R^{2}$$
 O $(R^{4})_{n}$ A Z R^{1} H R^{3} (Ia)

in welcher

n, A, R¹, R², R³, R⁴ und Z die in einem der Ansprüche 1 bis 6 angegebene Bedeutung haben.

- 160 -

- 9. Herbizide Mittel, gekennzeichnet durch den Gehalt mindestens einer Verbindung gemäß einem der Ansprüche 1 bis 6 und üblichen Streckmitteln.
- 10. Verwendung von mindestens einer Verbindung gemäß einem der Ansprüche1 bis 6 zur Bekämpfung von unerwünschten Pflanzen.

Inte. .donal Application No PCT/EP 00/02292

A CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER IPC 7 CO7D403/10 A01N

C07D403/10 C07D471/04 A01N43/653 C07D231/20

A01N43/56 C07D413/10 C07D401/10 C07D487/04 CO7D417/10

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) IPC 7 C07D A01N

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, CHEM ABS Data, WPI Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED T	O BE RELEVANT

Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
WO 99 07697 A (DEYN WOLFGANG VON ;HILL REGINA LUISE (DE); RHEINHEIMER JOACHIM (DE) 18 February 1999 (1999-02-18) page 78, line 21 -page 79, line 7	1,8-10
WO 98 42678 A (DOW AGROSCIENCES LLC) 1 October 1998 (1998-10-01) page 50, line 19 -page 51, line 15	1,8
WO 98 31681 A (DEYN WOLFGANG VON ;HILL REGINA LUISE (DE); RHEINHEIMER JOACHIM (DE) 23 July 1998 (1998-07-23) claim 1	1,9,10
EP 0 900 795 A (NIPPON SODA CO) 10 March 1999 (1999-03-10) claims 	1,9,10
-/	
	WO 99 07697 A (DEYN WOLFGANG VON; HILL REGINA LUISE (DE); RHEINHEIMER JOACHIM (DE) 18 February 1999 (1999-02-18) page 78, line 21 -page 79, line 7 WO 98 42678 A (DOW AGROSCIENCES LLC) 1 October 1998 (1998-10-01) page 50, line 19 -page 51, line 15 WO 98 31681 A (DEYN WOLFGANG VON; HILL REGINA LUISE (DE); RHEINHEIMER JOACHIM (DE) 23 July 1998 (1998-07-23) claim 1 EP 0 900 795 A (NIPPON SODA CO) 10 March 1999 (1999-03-10)

X Further documents are listed in the continuation of box C.

X Patent family members are listed in annex.

- Special categories of cited documents :
- "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- "E" earlier document but published on or after the international filing date
- "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- *O* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
 P document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed
- and the priority date dailing

- "T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.

Date of mailing of the International search report

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

27/07/2000

17 July 2000

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentiaan 2

NL – 2280 HV Rijswijk

Tel. (+31--70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,

Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

De Jong, B

Form PCT/ISA/210 (second sheet) (July 1992)

Inte Jonal Application No PCT/EP 00/02292

C.(Continu	INTERPOLATION DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT	
Category *		Relevant to claim No.
Α	US 5 846 907 A (HILL REGINA LUISE ET AL) 8 December 1998 (1998-12-08) claims; examples	1,9,10

Information on patent family members

Inte. onal Application No PCT/EP 00/02292

Patent docum		Publication date		Patent family member(s)	Publication date
WO 990769	7 A	18-02-1999	AU EP	9066598 A 1003736 A	01-03-1999 31-05-2000
WO 984267	8 A	01-10-1998	AU	6579198 A	20-10-1998
			EP	0918755 A	02-06-1999
			ÜS	5824802 A	20-10-1998
			US	5962690 A	05-10-1999
WO 983168	1 A	23-07-1998	AU	6092998 A	07-08-1998
			AU	6207698 A	07-08-1998
			AU	6613398 A	07-08-1998
			CN CN	1248255 T	22-03-2000
			WO	1250447 T 9831676 A	12-04-2000 23-07-1998
			WO	9831682 A	23-07-1998
			EP	0966452 A	29-12-1999
			ĒΡ	0958291 A	24-11-1999
			ËP	0958292 A	24-11-1999
			NO	993521 A	15-09-1999
			NO	993522 A	16-09-1999
			PL	334847 A	27-03-2000
			PL	334849 A	27-03-2000
			SK	90399 A	10-12-1999
			SK	91999 A 	18-01-2000
EP 090079	5 A	10-03-1999	JP	10007673 A	13-01-1998
			AU	1671097 A	19-11-1997
			BR	9708828 A	03-08-1999
			AU AU	1670797 A	19-11-1997
			AU	1670897 A 1670997 A	17-10-1997 19-11-1997
			AU	2405897 A	19-11-1997
			CA	2252543 A	06-11-1997
			CN	1216534 A	12-05-1999
			CN	1216543 A	12-05-1999
			EP	0891972 A	20-01-1999
			HU	9902423 A	29-11-1999
	•		JP	10237072 A	08-09-1998
			WO WO	9741116 A 9735850 A	06-11-1997 02-10-1997
			WO	9733850 A 9741117 A	02-10-1997
			WO	9741117 A 9741118 A	06-11-1997
			WO	9741105 A	06-11-1997
			WO	9821187 A	22-05-1998
US 5846907	7 A	08-12-1998	AU	710172 B	16-09-1999
			AU	4665596 A	11-09-1996
			BG	101825 A	30-04-1998
			BR	9607333 A	25-11-1997
			CA CN	2210693 A 1175951 A	29-08-1996 11-03-1998
			CZ	9702473 A	13-05-1998
			WO	9626206 A	29-08-1996
			EP	0811007 A	10-12-1997
			FI	973471 A	22-08-1997
			HU	9800725 A	28-07-1998
			JP	11500438 T	12-01-1999
			LT	97145 A,B	26-01-1998

information on patent family members

Inte. ional Application No PCT/EP 00/02292

cited in search report		
US 5846907 A	LV 11895 A LV 11895 B NO 973861 A NZ 301272 A PL 322277 A SK 104297 A	20-12-1997 20-03-1998 22-10-1997 25-02-1999 19-01-1998 08-07-1998

.onales Aktenzeichen PCT/EP 00/02292

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES IPK 7 C07D403/10 A01N43/653

C07D471/04

C07D231/20

A01N43/56 C07D413/10 C07D401/10 C07D487/04 C07D417/10

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole) IPK 7 CO7D AO1N

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

EPO-Internal, CHEM ABS Data, WPI Data

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	WO 99 07697 A (DEYN WOLFGANG VON ;HILL REGINA LUISE (DE); RHEINHEIMER JOACHIM (DE) 18. Februar 1999 (1999-02-18) Seite 78, Zeile 21 -Seite 79, Zeile 7	1,8-10
X	WO 98 42678 A (DOW AGROSCIENCES LLC) 1. Oktober 1998 (1998-10-01) Seite 50, Zeile 19 -Seite 51, Zeile 15	1,8
A	WO 98 31681 A (DEYN WOLFGANG VON ;HILL REGINA LUISE (DE); RHEINHEIMER JOACHIM (DE) 23. Juli 1998 (1998-07-23) Anspruch 1	1,9,10
4	EP 0 900 795 A (NIPPON SODA CO) 10. März 1999 (1999-03-10) Ansprüche	1,9,10

Weltere Veroffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen	X Siehe Anhang Patentfamilie
 Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen : "A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist "E" älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen 	T' Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondem nur zum Verständnie des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist
Anmeldedatum veröffentlicht worden ist "L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft er- scheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Bechernhenhericht oegenste. Veröffentlich und beliede	"X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf
soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt) "O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung.	erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden """ Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen
eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht *P* Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anneldedetum, aber nach	Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist *&* Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist Datum des Abschlusses der internationalen Recherche Absendedatum des internationalen Recherchenberichts 17. Juli 2000 27/07/2000 Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde Bevollmächtigter Bediensteter Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentiaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,

Formblatt PCT/ISA/210 (Blatt 2) (Juli 1992)

Fax: (+31-70) 340-3016

De Jong, B

Inte. onales Aktenzeichen PCT/EP 00/02292

	ing) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
ategorie*	Bezeichnung der Veromentlichung, soweit et totestate unter Angeboten	
	US 5 846 907 A (HILL REGINA LUISE ET AL) 8. Dezember 1998 (1998-12-08) Ansprüche; Beispiele	1,9,10
		·

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Inter. Inales Aktenzeichen
PCT/EP 00/02292

	echerchenberich tes Patentdoku		Datum der Veröffentlichung		litglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO	9907697	Α	18-02-1999	AU	9066598 A	01-03-1999
				EP	1003736 A	31-05-2000
WO	9842678	A	01-10-1998	AU	6579198 A	20-10-1998
				EP	0918755 A	02-06-1999
				US US	5824802 A 5962690 A	20-10-1998 05-10-1999
						05-10-1999
WO	9831681	A	23-07-1998	AU	6092998 A 6207698 A	07-08-1998
				UA UA	6613398 A	07-08-1998 07-08-1998
				CN	1248255 T	22-03-2000
				CN	1250447 T	12-04-2000
				WO	9831676 A	23-07-1998
				WO	9831682 A	23-07-1998
				EP	0966452 A	29-12-1999
				EP	0958291 A	24-11-1999
				EP	0958292 A	24-11-1999
				NO NO	993521 A 993522 A	15-09-1999 16-09-1999
				PL	334847 A	27-03-2000
				PL	334849 A	27-03-2000
				SK	90399 A	10-12-1999
				SK	91999 A	18-01-2000
ΕP	0900795	Α	10-03-1999	JP	10007673 A	13-01-1998
				AU	1671097 A	19-11-1997
				BR	9708828 A	03-08-1999
				AU	1670797 A	19-11-1997
				UA UA	1670897 A 1670997 A	17-10-1997 19-11-1997
				AU	2405897 A	19-11-1997
				CA	2252543 A	06-11-1997
				CN	1216534 A	12-05-1999
				CN	1216543 A	12-05-1999
				EP	0891972 A	20-01-1999
				HU Jp	9902423 A	29-11-1999
				WO	10237072 A 9741116 A	08-09-1998 06-11-1997
				WO	9735850 A	02-10-1997
				WO	9741117 A	06-11-1997
				WO	9741118 A	06-11-1997
				WO	9741105 A	06-11-1997
				WO	9821187 A	22-05-1998
US !	5846907	Α	08-12-1998	AU	710172 B	16-09-1999
				AU	4665596 A	11-09-1996
				BG BR	101825 A 9607333 A	30-04-1998 25-11-1997
				CA	2210693 A	29-08-1996
			ČN	1175951 A	11-03-1998	
			CZ	9702473 A	13-05-1998	
		WO	9626206 A	29-08-1996		
				EP	0811007 A	10-12-1997
				FI	973471 A	22-08-1997
				HU	9800725 A	28-07-1998
				JP LT	11500438 T 97145 A,B	12-01-1999 26-01-1998
				LI	9/140 A,D	ZO_01-1388

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Int. .ionales Aktenzeichen
PCT/EP 00/02292

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung		glied(er) der atentfamilie	Datum der Veröffentlichung
US 5846907 A		LV LV NO NZ PL SK	11895 A 11895 B 973861 A 301272 A 322277 A 104297 A	20-12-1997 20-03-1998 22-10-1997 25-02-1999 19-01-1998 08-07-1998